

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2002 年 5 月 23 日 (23.05.2002)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 02/40473 A1

(51) 国際特許分類: C07D 409/06, 405/06, 417/06, 403/06, 239/38, 495/04, 401/06, 239/26, 239/34, 239/30, 409/14, 411/14, A01N 43/54, 43/78, 43/90, 47/16, 55/00

[JP/JP]; 〒525-0025 滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/10060

(74) 代理人: 泉名謙治, 外 (SENMYO, Kenji et al.); 〒101-0042 東京都千代田区神田東松下町38番地 鳥本鋼業ビル Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2001 年 11 月 16 日 (16.11.2001)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願 2000-351765  
2000 年 11 月 17 日 (17.11.2000) JP

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 石原産業株式会社 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) [JP/JP]; 〒550-0002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 Osaka (JP).

(72) 発明者: および

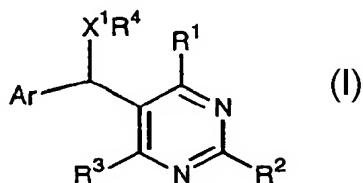
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小柳 徹 (KOYANAGI, Toru) [JP/JP]. 菊川弘司 (KIKUGAWA, Hiroshi) [JP/JP]. 中山仁志 (NAKAYAMA, Hitoshi) [JP/JP]. 宮下聖子 (MIYASHITA, Seiko) [JP/JP]. 永山宗一郎 (NAGAYAMA, Souichiro) [JP/JP]. 佐野真喜子 (SANO, Makiko) [JP/JP]. 大野 研 (OHNO, Ken)

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PYRIMIDINE COMPOUNDS OR SALTS THEREOF, HERBICIDES CONTAINING THE COMPOUNDS OR THE SALTS, METHODS FOR CONTROL OF WEEDS BY APPLYING THE SAME

(54) 発明の名称: ピリミジン系化合物またはその塩、それらを含む除草剤、ならびにそれらを施用する有害雑草の防除方法



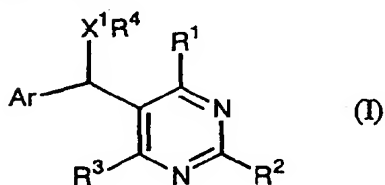
(57) Abstract: Pyrimidine compounds represented by the general formula (I) or salts thereof; and herbicides containing the compounds or the salts: (I) wherein Ar is optionally substituted thienyl, optionally substituted furyl, or the like; R<sup>1</sup> is hydrogen, halogeno, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted alkenyl, optionally substituted alkynyl, optionally substituted cycloalkyl, or the like; R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> are each hydrogen, halogeno, alkyl, haloalkyl, alkoxy, or alkylthio; R<sup>4</sup> is hydrogen, optionally substituted alkyl, -CH<sub>2</sub>CN, optionally substituted alkenyl, optionally substituted alkynyl, optionally substituted cycloalkyl, or the like; and X<sup>1</sup> is oxygen or sulfur.

[続葉有]



(57) 要約:

式 (I) ;



[式中、Arは置換されてもよいチエニル、置換されてもよいフリルなどであり、 $\text{R}^1$ は水素原子、ハロゲン、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルコキシ、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキルなどであり、 $\text{R}^2$ 及び $\text{R}^3$ は各々水素原子、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はアルキルチオであり、 $\text{R}^4$ は水素原子、置換されてもよいアルキル、 $-\text{CH}_2\text{CN}$ 、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキルなどであり、 $\text{X}^1$ は酸素原子又は硫黄原子である]で表されるピリミジン系化合物又はその塩並びにそれらを含む除草剤。

## 明 細 書

ピリミジン系化合物またはその塩、それらを含む除草剤、ならびにそれらを施用する有害雑草の防除方法

## 技術分野

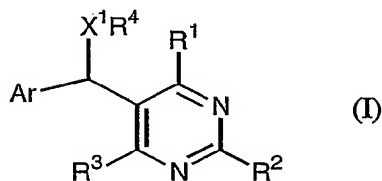
本発明は、除草剤の有効成分として有用な新規ピリミジン系化合物に関する。

## 背景技術

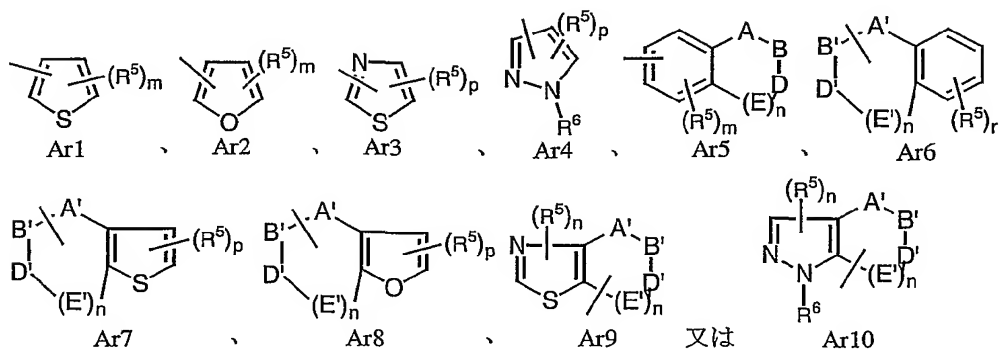
WO 98/11074には、後記式 (I) で表されるピリミジン系化合物に近似した化合物が開示されているが、後記式 (I) 中の Ar で表される置換基などによって区別される。

## 発明の開示

本願発明者等は、より優れた除草剤を見出すべくピリミジン系化合物につき種々検討した結果、本発明を完成した。すなわち本発明は、式 (I) ；



[式中、Ar は



であり、A、B、D、E、A'、B'、D' 及び E' は各々酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^9)-$ 、 $=N-$ 、 $=C(R^9)-$  又は  $-C(R^9)_2-$  (ここでの  $R^9$  は同一でも異なってもよい) であり (但し、 $-A'-B'-D'-(E')_n-$  が環内の二重結合と共役してベンゼン環を形成する場合を除く)、 $R^1$  は水素原子、ハロゲン、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルコキシ、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-N(R^6)_2$  (ここでの  $R^6$  は同一であっても異なってもよいし、2つの  $R^6$  が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい) 又は  $R^8$  で置換されてもよいフェニルであり、 $R^2$  及び  $R^3$  は各々水素原子、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はアルキルチオであり、 $R^4$  は水素原子、置換されてもよいアルキル、 $-CH_2CN$ 、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-C(=X^2)R^7$ 、 $R^8$  で置換されてもよいフェニル又は  $R^8$  で置換されてもよいピリジルであり、 $R^5$  はハロゲン、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、ニトロ、シアノ、ホルミル、 $-SR^6$ 、 $-SOR^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-COR^6$ 、 $-COOR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$  (ここでの  $R^6$  は同一であっても異なってもよいし、2つの  $R^6$  が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい)、 $-C(X^3R^{10})(X^4R^{11})$  又は  $R^8$  で置換されてもよいフェニルであり、 $R^6$  は水素原子、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $R^8$  で置換されてもよいフェニル又は  $R^8$  で置換されてもよいピリジルであり、 $R^7$  は置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$  (ここでの  $R^6$  は同一であっても異なってもよいし、2つの  $R^6$  が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい) 又は  $R^8$  で置換されてもよいフェニルで

あり、 $R^8$ はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ニトロ又はシアノであり、 $R^9$ は水素原子、ハロゲン、アルキル又はハロアルキルであり、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は各々アルキル（ $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は一緒になって環を形成することもできる）であり、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 及び $X^4$ は各々酸素原子又は硫黄原子であり、 $n$ は0又は1であり、 $m$ は0～3であり、 $p$ は0～2であり、 $r$ は0～4であり、 $m$ 、 $p$ 又は $r$ が2以上である場合、 $R^5$ は同一であっても異なってもよい、但し、(1)  $Ar$ がチエニル又はフリルであり、 $R^1$ がハロアルキルであり、且つ、 $R^2$ 及び $R^3$ がともに水素原子である場合、(2)  $Ar$ がチエニル又はフリルであり、 $X^1$ が酸素原子であり、 $R^1$ がアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル、ハロシクロアルキル又は置換されてもよいフェニル（ここでの置換基はハロゲン、アルキル又はハロアルキル）であり、且つ、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ がともに水素原子である場合、(3)  $Ar$ が置換されてもよいチアゾリル（ここでの置換基はハロゲン、アルキル、フルオロアルキル、アルコキシ、ジアルキルアミノ、アルコキシカルボニル、アルカノイル、ニトロ又はシアノ）であり、 $X^1$ が酸素原子であり、 $R^1$ が $-SR^6$ であり、 $R^4$ が水素原子、アルキル、フルオロアルキル、アルキルチオアルキル、アルケニル、アルキニル、アルカノイル又は置換されてもよいベンゾイル（ここでの置換基はハロゲン又はアルキル）であり、且つ、 $R^6$ が置換されてもよいフェニル（ここでの置換基はハロゲン、アルキル、フルオロアルキル又はシアノ）である場合、(4)  $Ar$ が置換されてもよいチアゾリル（ここでの置換基はアルキル、トリフルオロメチル、フェニルアルキル又はトリフェニルメチル）であり、 $X^1$ が酸素原子又は硫黄原子であり、 $R^1$ が水素原子又はメチルであり、 $R^2$ 及び $R^3$ が各々水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル又はメトキシであり、且つ、 $R^4$ が置換されてもよいフェニル（ここでの置換基はフッ素原子、塩素原子、臭素原子、アルキル、クロロアルキル又はブロモアルキル）である場合並びに(5)  $Ar$ が置換されてもよいピラゾール-5-イル（ここでの置換基は、置換されてもよいフェノキシ、置換されてもよいフェニルチオ、置換されてもよいフェニルスルフィニル又は置換されてもよいフェニルスルホニル）であり、 $X^1$ が酸素原子であり、 $R^4$ が水素原子

、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアリル、フェニルアルキル（フェニル部分は置換されていてもよい）、アルケニル、アルキニル又は $-COR^7$ であり、 $R^7$ がアルキル、ハロアルキル、フェニルアルキル（フェニル部分は置換されていてもよい）、アルコキシ、 $-N(R^6)_2$ 又は置換されてもよいフェニルであり、且つ、 $R^6$ がアルキル又は置換されてもよいフェニルである場合を除く]で表されるピリミジン系化合物又はその塩、それらの製造方法、それらを含む除草剤及びそれらの有効成分量を施用して有害雑草を防除する方法等に関する。

$R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 及び $R^7$ に含まれる置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルコキシ、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニルの置換基としては、例えばハロゲン、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ、 $C_{1-6}$ ジアルキルアミノ、トリメチルシリル、 $R^8$ で置換されてもよいフェニルなどが挙げられる。これら置換基の置換数は、1又は2以上であってもよく、2以上の場合、それらの置換基は同一でも相異なってもよい。

$R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 及び $R^7$ に含まれる置換されてもよいシクロアルキルの置換基としては、例えばハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオ、 $R^8$ で置換されてもよいフェニルなどが挙げられる。これら置換基の置換数は、1又は2以上であってもよく、2以上の場合、それらの置換基は同一でも相異なってもよい。

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ 中のアルキル又はアルキル部分としては、各々炭素数1～6の直鎖又は分枝状のもの、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシルなどが挙げられる。

$R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 及び $R^7$ 中のアルケニル又はアルケニル部分としては、各々炭素数2～6の直鎖又は分枝状のもの、例えばビニル、プロペニル、イソプロペニル、ブテニル、ペンテニル、ヘキセニルなどが挙げられる。

$R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 及び $R^7$ 中のアルキニル又はアルキニル部分としては、各々炭素数2～6の直鎖又は分枝状のもの、例えばエチニル、プロピニル、ブチニル、イソブチニル、ペンチニル、ヘキシニルなどが挙げられる。

$R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  及び  $R^7$  中シクロアルキルとしては、炭素数 3～6 のもの、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどが挙げられる。

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  及び  $R^9$  中のハロゲン又は置換基としてのハロゲンとしては、フッ素、塩素、臭素又は沃素の各原子が挙げられる。置換基としてのハロゲンの数は 1 又は 2 以上であってよく、2 以上の場合、各ハロゲンは同一でも相異なってもよい。また、ハロゲンの置換位置はいずれの位置でもよい。

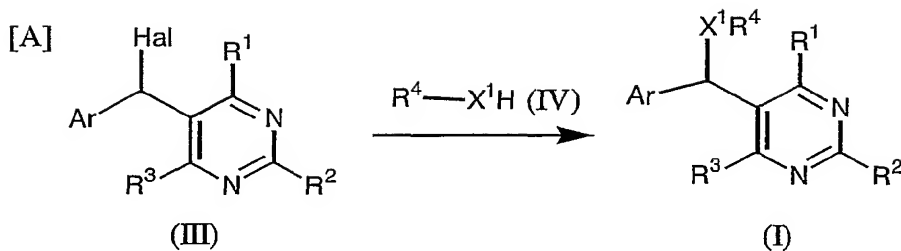
$R^5$  及び  $R^7$  中の  $-N(R^6)_2$  の 2 つの  $R^6$  が一緒になって環を形成する場合、例えばピロリジニル、イミダゾリジニル、ピラゾリジニル、ピペリジル、ピペラジニル、モルホリニルなどを形成する。

$R^{10}$  及び  $R^{11}$  中のアルキルが一緒になって環を形成する場合、例えば 1, 3-ジチアン-2-イル、1, 3-ジオキサン-2-イル、1, 3-ジオキソラン-2-イル、1, 3-ジチオラン-2-イル、1, 3-オキサチオラン-2-イルなどを形成する。

前記式 (I) で表されるピリミジン系化合物は、塩を形成することが可能である。その塩としては、農業上許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えばナトリウム塩、カリウム塩のようなアルカリ金属塩；マグネシウム塩、カルシウム塩のようなアルカリ土類金属塩；ジメチルアミン塩、トリエチルアミン塩のようなアンモニウム塩などが挙げられる。

前記式 (I) で表されるピリミジン系化合物には、光学異性体又は幾何異性体が存在し、本発明には各異性体及び異性体混合物の双方が含まれる。

前記式 (I) で表されるピリミジン系化合物又はその塩（以下本発明化合物と略す）は、以下の反応 [A] ～ [D] 或は通常の前記式 (I) の製造方法に従って製造することができる。



反応〔A〕中、Ar、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びX<sup>1</sup>は前述の通りであり、Halはハロゲンである。

反応〔A〕は、通常塩基及び溶媒の存在下で行う。

塩基は、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物；n-ブチルリチウム、t-ブチルリチウムのようなアルキルリチウム；トリエチルアミン、ピリジン、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]7-ウンデセンのような3級アミン；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；ナトリウムメトキシド、カリウムt-ブトキシドのようなアルコール塩などから、1種又は2種以上を適宜選択する。

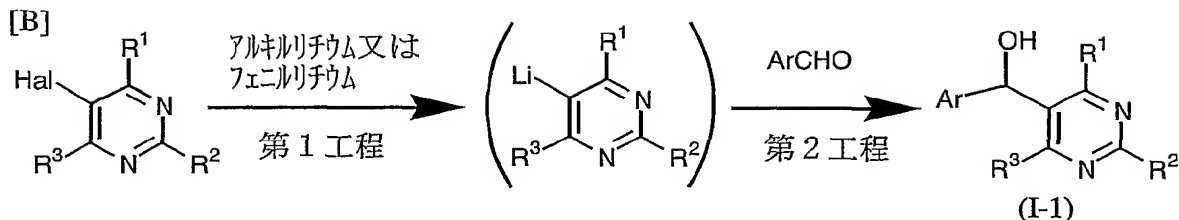
溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばN, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドのような極性非プロトン性溶媒；ジエチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類などから、1種又は2種以上を適宜選択する。

反応〔A〕は、必要に応じ不活性ガスの存在下で行う。

不活性ガスは、例えば窒素、ヘリウム、アルゴンなどから適宜選択する。

反応〔A〕の反応温度及び反応時間は、化合物の種類、反応条件の相違などによって異なり、一概に規定できないが、反応温度は通常-80～+120℃、望ましくは0～100℃であり、反応時間は通常1～24時間、望ましくは2～6時間である。但し、最適な反応温度及び反応時間は、各種反応条件を勘案し、適宜予備試験を行うなどして個別に決定することができる。





反応〔B〕中、Ar、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びHalは前述の通りである。

反応〔B〕の第1工程は、通常溶媒及び不活性ガスの存在下で行う。

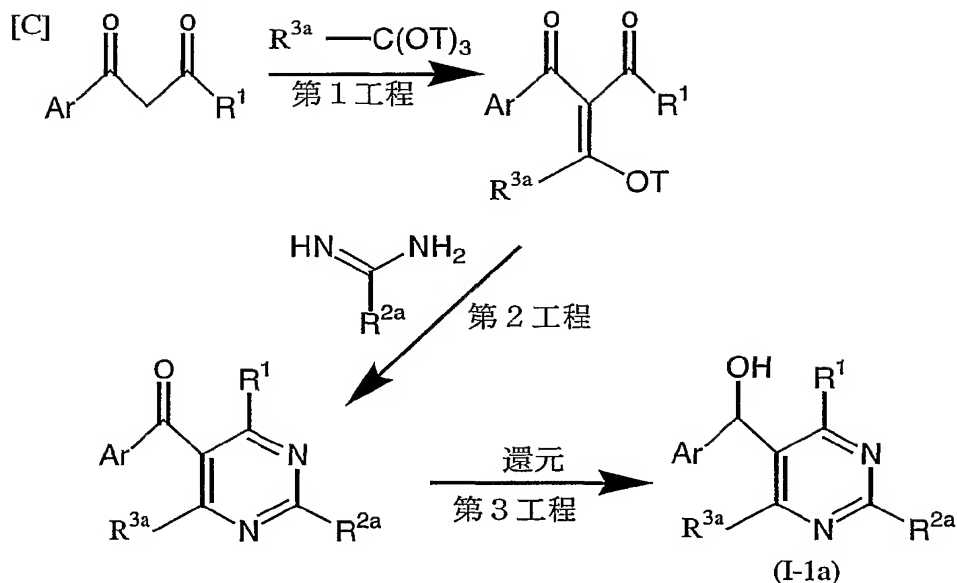
溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばテトラヒドロフラン、ジエチルエーテルのようなエーテル類などから、1種又は2種以上を適宜選択する。

不活性ガスは、例えば窒素、ヘリウム、アルゴンなどから適宜選択する。

反応〔B〕の第1工程の反応温度及び反応時間は、化合物の種類、反応条件の相違などによって異なり、一概に規定できないが、反応温度は通常−120〜−50℃、望ましくは−100〜−70℃であり、反応時間は通常0.05〜6時間、望ましくは0.1〜3時間である。但し、最適な反応温度及び反応時間は、各種反応条件を勘案し、適宜予備試験を行うなどして個別に決定することができる。

反応〔B〕の第2工程は、通常第1工程に引き続いて行い、その際第1工程で使用した溶媒又は不活性ガスをそのまま使用することができるが、場合によっては、前記第1工程で挙げた溶媒又は不活性ガスを追加的に使用してもよい。

反応〔B〕の第2工程の反応温度及び反応時間は、化合物の種類、反応条件の相違などによって異なり、一概に規定できないが、反応温度は通常−120〜+50℃、望ましくは−80〜+30℃であり、反応時間は通常2〜24時間、望ましくは3〜16時間である。但し、最適な反応温度及び反応時間は、各種反応条件を勘案し、適宜予備試験を行うなどして個別に決定することができる。



反応〔C〕中、Ar及びR<sup>1</sup>は前述の通りであり、R<sup>2a</sup>及びR<sup>3a</sup>は各々水素原子又はアルキルであり、Tはアルキル（望ましくはメチル、エチル又はプロピル）である。

反応〔C〕の第1工程は、通常溶媒及び縮合剤の存在下で行う。

溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば酢酸、プロピオン酸のような有機酸などから、1種又は2種以上を適宜選択する。

縮合剤は、例えば無水酢酸、無水プロピオン酸のような有機酸無水物などから適宜選択する。

反応〔C〕の第1工程の反応温度及び反応時間は、化合物の種類、反応条件の相違などによって異なり、一概に規定できないが、反応温度は通常40～150℃、望ましくは80～120℃であり、反応時間は通常1～24時間、望ましくは6～12時間である。但し、最適な反応温度及び反応時間は、各種反応条件を勘案し、適宜予備試験を行うなどして個別に決定することができる。

反応〔C〕の第2工程は、通常溶媒の存在下で行う。

溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒；アセトニトリル

、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類；メタノール、エタノール、プロパノール、ターシャリーブタノールのようなアルコール類などから、1種又は2種以上を適宜選択する。

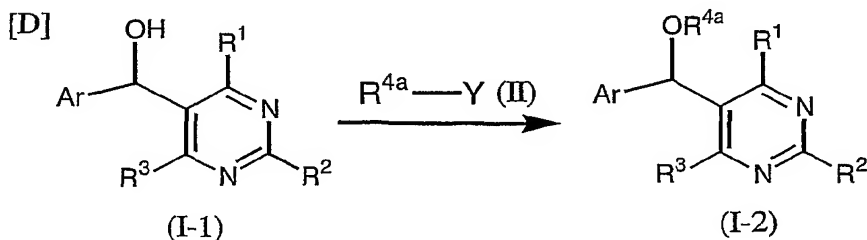
反応〔C〕の第2工程の反応温度及び反応時間は、化合物の種類、反応条件の相違などによって異なり、一概に規定できないが、反応温度は通常0～100℃、望ましくは20～80℃であり、反応時間は通常0.5～12時間、望ましくは3～6時間である。但し、最適な反応温度及び反応時間は、各種反応条件を勘案し、適宜予備試験を行うなどして個別に決定することができる。

反応〔C〕の第3工程は、ケトンからアルコールを製造する通常の還元反応に準じて行う。還元試薬としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化アルミニウムリチウムをはじめ、新実験化学講座15、酸化と還元〔II〕、12～13頁に記載されたものから適宜選択して使用できる。

反応〔C〕の第3工程は、通常溶媒の存在下で行う。

溶媒は、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、プロパノール、ターシャリーブタノールのようなアルコール類；水などから、前記還元試薬の種類に応じて1種又は2種以上を適宜選択する。

反応〔C〕の第3工程の反応温度及び反応時間は、化合物の種類、反応条件の相違などによって異なり、一概に規定できないが、反応温度は通常－20～＋100℃、望ましくは0～80℃であり、反応時間は通常0.5～12時間、望ましくは1～6時間である。但し、最適な反応温度及び反応時間は、各種反応条件を勘案し、適宜予備試験を行うなどして個別に決定することができる。



反応〔D〕中、Ar、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は前述の通りであり、R<sup>4a</sup>は置換されてもよいアルキル、-CH<sub>2</sub>CN、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、-C(=X<sup>2</sup>)R<sup>7</sup>又はR<sup>8</sup>で置換されてもよいフェニル(X<sup>2</sup>、R<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>は前述の通り)であり、Yは塩素原子、臭素原子のようなハロゲン或はp-トルエンスルホニルオキシ、メタンスルホニルオキシのような有機スルホン酸残基である。

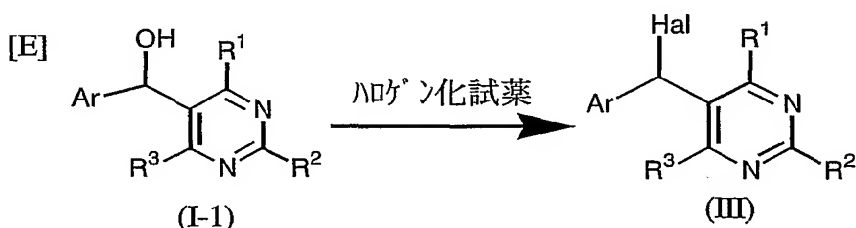
反応〔D〕は、通常塩基及び溶媒の存在下で行う。塩基及び溶媒としては、前記反応〔A〕で例示したものから、1種又は2種以上を適宜選択する。

反応〔D〕は、必要に応じ不活性ガスの存在下で行う。

不活性ガスは、例えば窒素、ヘリウム、アルゴンなどから適宜選択する。

反応〔D〕反応温度及び反応時間は、化合物の種類、反応条件の相違などによって異なり、一概に規定できないが、反応温度は通常-80~+100℃、望ましくは0~50℃であり、反応時間は通常1~24時間、望ましくは2~6時間である。但し、最適な反応温度及び反応時間は、各種反応条件を勘案し、適宜予備試験を行うなどして個別に決定することができる。

前記反応〔A〕で使用される式(III)で表される化合物は、新規化合物を含む。この化合物は、以下の反応〔E〕に従って製造することができる。



反応〔E〕中、Ar、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びHalは前述の通りである。

反応〔E〕は、ハロゲン化試薬の存在下で行う。

ハロゲン化試薬としては、例えば塩化チオニル、オキシ塩化リン、5塩化リン、臭化チオニル、オキシ臭化リン、5臭化リンなどが使用できる。

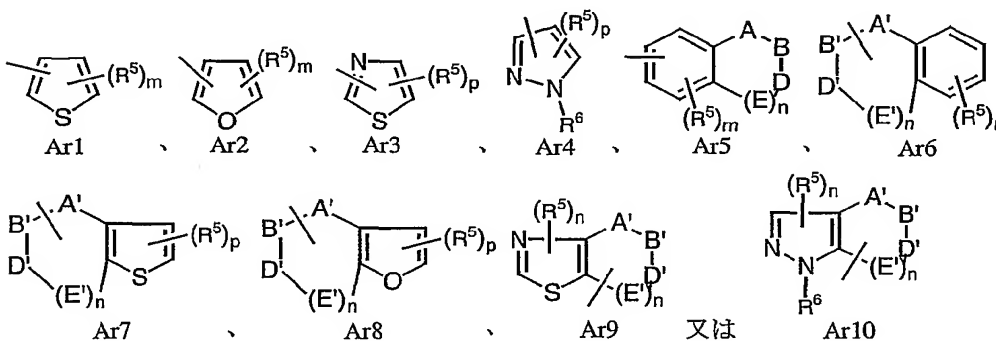
反応〔E〕は、必要に応じ溶媒の存在下で行うが、一般には、溶媒を使用する方が望ましい。

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエンのような芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルムのようなハロゲン化アルキル類などから、1種又は2種以上を適宜選択する。

反応〔E〕の反応温度及び反応時間は、化合物の種類、反応条件の相違などによって異なり、一概に規定できないが、反応温度は通常 $-40\sim+150^{\circ}\text{C}$ 、望ましくは $0\sim60^{\circ}\text{C}$ であり、反応時間は通常1～24時間、望ましくは2～6時間である。但し、最適な反応温度及び反応時間は、各種反応条件を勘案し、適宜予備試験を行うなどして個別に決定することができる。

本発明化合物の中で、特に望ましい化合物は以下のものである。

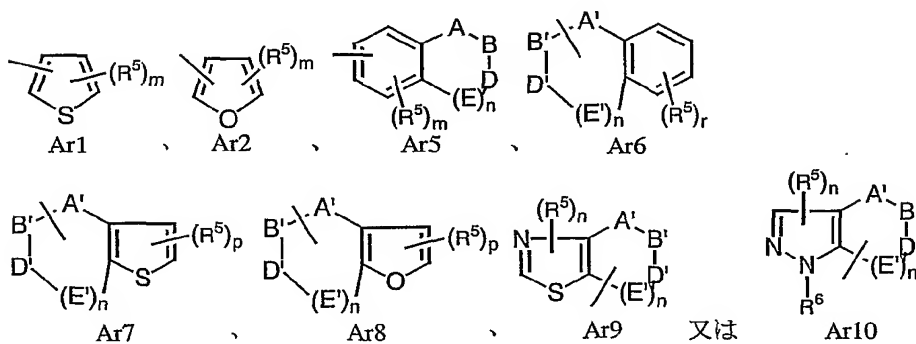
(1) Arが



であり、A、B、D、E、A'、B'、D' 及び E' は各々酸素原子、硫黄原子、 $-\text{N}(\text{R}^9)-$ 、 $=\text{N}-$ 、 $=\text{C}(\text{R}^9)-$ 又は $-\text{C}(\text{R}^9)_2-$ （ここでの $\text{R}^9$ は同一でも異なってもよい）であり（但し、 $-\text{A}'-\text{B}'-\text{D}'-(\text{E}')_n-$ が環内の二重結合と共役してベンゼン環を形成する場合を除く）、 $\text{R}^1$ が水素原子、置換されてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル、置換されてもよい $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、置換されてもよい $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、置換されてもよい $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル、 $-\text{SR}^6$ 又は $\text{R}^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $\text{R}^2$ 及び $\text{R}^3$ が各々水素原子、ハロゲン、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル又は $\text{C}_{1-6}$ アルコキシであり、 $\text{R}^4$ が水素原子、置換されてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{CN}$ 、置換されてもよい $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、置換されてもよい $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、置換されてもよい $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル、 $-\text{C}(=\text{X}^2)\text{R}^7$ 又は $\text{R}^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $\text{R}^5$ がハロゲン、置換

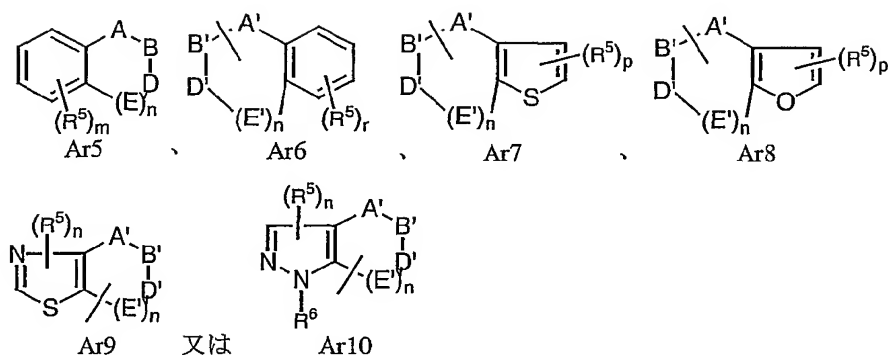
されてもよい $C_{1-6}$ アルキル、置換されてもよい $C_{2-6}$ アルケニル、置換されてもよい $C_{2-6}$ アルキニル、置換されてもよい $C_{3-6}$ シクロアルキル、ニトロ、シアノ、ホルミル、 $-SR^6$ 、 $-SOR^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-COR^6$ 、 $-COOR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$ （ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよく、或は2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもできる）又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^6$ が置換されてもよい $C_{1-6}$ アルキル、置換されてもよい $C_{2-6}$ アルケニル、置換されてもよい $C_{2-6}$ アルキニル、置換されてもよい $C_{3-6}$ シクロアルキル又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^7$ が置換されてもよい $C_{1-6}$ アルキル、置換されてもよい $C_{2-6}$ アルケニル、置換されてもよい $C_{2-6}$ アルキニル、置換されてもよい $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$ （ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよく、或は2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもできる）又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^8$ がハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル又は $C_{1-6}$ ハロアルキルであり、 $R^9$ が水素原子、ハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル又は $C_{1-6}$ ハロアルキルであり、 $X^1$ 及び $X^2$ が各々酸素原子又は硫黄原子であり、 $n$ が0又は1であり、 $m$ が0～3であり、 $p$ が0～2であり、 $r$ が0～4であり、 $m$ 、 $p$ 又は $r$ が2以上である場合、 $R^5$ は同一であっても異なってもよい前記式（I）のピリミジン系化合物又はその塩。

(2)  $Ar$ が、



である前記式（I）のピリミジン系化合物又はその塩。

(3)  $Ar$ が、



である前記式 (I) のピリミジン系化合物又はその塩。

本発明化合物は、除草剤の有効成分として使用した場合に優れた除草効果を示す。その適用範囲は、水田、畑地、果樹園、桑園などの農耕地、山林、農道、グラウンド、工場敷地などの非農耕地と多岐にわたり、適用方法も土壌処理、茎葉処理、湛水処理等を適宜選択できる。

本発明化合物は、例えばイヌビエ、メヒシバ、エノコログサ、アキノエノコログサ、オヒシバ、カラスムギ、セイバンモロコシ、シバムギ、ビロードキビ、パラグラス、アゼガヤ、イトアゼガヤ、スズメノカタビラ、スズメノテッポウなどのイネ科雑草、コゴメガヤツリ、ハマスゲ、キハマスゲ、ホタルイ、ミズガヤツリ、タマガヤツリ、マツバイ、クログワイなどのカヤツリグサ科雑草、ウリカワ、オモダカ、ヘラオモダカなどのオモダカ科雑草、コナギ、ミズアオイなどのミズアオイ科雑草、アゼナ、アブノメなどのゴマノハグサ科雑草、キカシグサ、ヒメミソハギなどのミソハギ科雑草の他、イチビ、マルバアサガオ、シロザ、アメリカキンゴジカ、スベリヒユ、アオビユ、アオゲイトウ、エビスグサ、イヌホウズキ、サナエタデ、ハコベ、オナモミ、タネツケバナ、ホトケノザ、ブタクサ、ヤエムグラ、セイヨウヒルガオ、チョウセンアサガオ、エゾノキツネアザミ、エノキグサなどの広葉雑草などの有害雑草を防除することができる為、有用作物、例えばトウモロコシ、ダイズ、ワタ、コムギ、イネ、オオムギ、エンバク、ソルガム、アブラナ、ヒマワリ、テンサイ、サトウキビ、芝、ピーナッツ、アマ、タバコ、コーヒーなどの栽培において選択的に有害雑草を防除する場合或は非選択的に有害雑草を防除する場合において有効に使用される。特に本発明化合物は、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、コムギ、イネ、アブラナ、ヒマワリ、テンサイ、

サトウキビ、芝、ピーナッツ、アマ、タバコ、コーヒーなどの栽培、その中でもトウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネなどの栽培において選択的に有害雑草を防除する場合において有効に使用される。

本発明化合物は通常各種農業上の補助剤と混合して粉剤、粒剤、顆粒水和剤、水和剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤、水溶剤、乳剤、錠剤、カプセル剤などの形態に製剤し、除草剤として使用されるが、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、珪藻土、消石灰、炭酸カルシウム、タルク、ホワイトカーボン、カオリン、ベントナイト、カオリナイト及びセリサイトの混合物、クレー、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、澱粉などの固型担体；水、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、ジオキサン、アセトン、イソホロン、メチルイソブチルケトン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、N-メチル-2-ピロリドン、アルコールなどの溶剤；脂肪酸塩、安息香酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリカルボン酸塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキル硫酸塩、アルキルアリール硫酸塩、アルキルジグリコールエーテル硫酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルジフェニルエーテルジスルホン酸塩、ポリスチレンスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、アルキルアリールリン酸塩、スチリルアリールリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物の塩のような陰イオン系の界面活性剤や展着剤；ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセライド、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシアルキレンブロックポリマー、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエ



チレンスチリルアリールエーテル、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのような非イオン系の界面活性剤や展着剤；オリーブ油、カボック油、ひまし油、シュロ油、椿油、ヤシ油、ごま油、トウモロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィンなどの植物油や鉱物油などが挙げられる。これら補助剤は本発明の目的から逸脱しないかぎり、当該分野で知られたものの中から選んで用いることができる。また、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、薬害軽減剤、防黴剤など通常使用される各種補助剤も使用することができる。本発明化合物と各種補助剤との配合割合は0.1 : 99.9 ~ 95 : 5、望ましくは0.2 : 99.8 ~ 85 : 15である。

本発明化合物を含有する除草剤の施用量は、気象条件、土壌条件、製剤形態、対象雑草の種類、施用時期などの相違により一概に規定できないが、一般に1ヘクタール当り本発明化合物が0.5 ~ 5000g、望ましくは1 ~ 1000g、更に望ましくは10 ~ 500gとなるように施用する。本発明には、このような除草剤の施用による有害雑草の防除方法も含まれる。

また、本発明化合物を含有する除草剤は、他の農薬、肥料、薬害軽減剤などと混用或は併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。他の農薬としては、除草剤、殺菌剤、抗生物質、植物ホルモン、殺虫剤などが挙げられる。特に、本発明化合物と他の除草剤の有効成分化合物の1種又は2種以上とを混用或は併用した混合除草性組成物は、適用草種の範囲、薬剤処理の時期、除草活性等を好ましい方向へ改良することが可能である。尚、本発明化合物と他の除草剤の有効成分化合物は各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用しても、両者を一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、前記した混合除草性組成物も含まれる。

本発明化合物と他の除草剤の有効成分化合物との混合比は、気象条件、土壌条件、薬剤の製剤形態、施用時期、施用方法などの相違により一概に規定できない

が、本発明化合物 1 重量部に対し、他の除草剤は有効成分化合物を 1 種あたり 0.01~10000 重量部、望ましくは 0.01~1000 重量部配合する。また、施用適量は 1 ヘクタール当りの総有効成分化合物量として 0.1~10000g、望ましくは 0.2~5000g、更に望ましくは 10~3000g である。本発明には、このような混合除草性組成物の施用による有害雑草の防除方法も含まれる。

他の除草剤の有効成分化合物としては、下記するもの（一般名；一部 ISO 申請中を含む）が例示できるが、特に記載がない場合であってもこれら化合物に塩、アルキルエステル等が存在する場合は、当然それらも含まれる。

(1) 2, 4-D、2, 4-DP、MCPA、MCPB、MCP、ナプロアニリド (naproanilide) のようなフェノキシ系、2, 3, 6-TBA、ジカンバ (dicamba)、ジクロベニル (dichlobenil)、ピクロラム (picloram)、クロピラリド (clorpyralid) のような芳香族カルボン酸系、その他ベナゾリン (benazolin)、キンクロラック (quinclorac)、キンメラック (quinmerac)、ダイフルフェンゾピル (diflufenzopyr)、チアゾピル (thiazopyr) などのように植物のホルモン作用を攪乱することで除草効力を示すとされているもの。

(2) クロロトルロン (chlorotoluron)、ジウロン (diuron)、フルオメツロン (fluometuron)、リニュロン (linuron)、イソプロチュロン (isoproturon)、メトベンズロン (metobenzuron)、テブチウロン (tebuthiuron) のような尿素系、シマジン (simazine)、アトラジン (atrazine)、アトラトン (atratone)、シメトリン (simeetryn)、プロメトリン (prometryn)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ヘキサジノン (hexazinone)、メトリブジン (metribuzin)、テルブチラジン (terbuthylazine)、シアナジン (cyanazine)、アメトリン (ametryn)、シブトリン (cybutryne)、トリアジフラム (triaziflam)、プロパジン (propazine) のようなトリアジン系、ブロマシル (bromac

il)、レナシル(lenacil)、ターバシル(terbacil)、のようなウラシル系、プロパニル(propanil)、シプロミッド(cypromid)のようなアニリド系、スエップ(sweep)、デスメディファム(desmedipham)、フェンメディファム(phenmedipham)のようなカーバメート系、ブロモキシニル(bromoxynil)、ブロモキシニル・オクタノエート(bromoxynil-octanoate)、アイオキシニル(ioxynil)のようなヒドロキシベンゾニトリル系、その他ピリデート(pyridate)、ベンタゾン(bentazon)、アミカルバゾン(amicarbazone)などのように植物の光合成を阻害することで除草効力を示すとされているもの。

(3) それ自身が植物体中でフリーラジカルとなり、活性酸素を生成させて速効的な除草効力を示すとされているパラコート(paraquat)、ジクワット(diquat)のような4級アンモニウム塩系。

(4) ニトロフェン(nitrofen)、クロメトキシフェン(chlomeoxyfen)、ビフェノックス(bifenox)、アシフルオルフェンナトリウム塩(acifluorfen-sodium)、ホメサフェン(fomesafen)、オキシフルオルフェン(oxyfluorfen)、ラクトフェン(lactofen)、エトキシフェンエチル(ethoxyfen-ethyl)のようなジフェニルエーテル系、クロルフタリム(chlorophthalim)、フルミオキサジン(flumioxazin)、フルミクロラックペンチル(flumiclorac-pentyl)、フルチアセツトメチル(fluthiacet-methyl)のような環状イミド系、その他オキサジアアルギル(oxadiargyl)、オキサジアゾン(oxadiazon)、スルフエントラゾン(sulfentrazone)、カーフェントラゾンエチル(carfentrazone-ethyl)、チジアジミン(thidiazimin)、ペントキサゾン(pentoxazone)、アザフェニジン(azafenidin)、ピラフルフェンエチル(pyraflufen-ethyl)、ベンズフェンジゾン(benzfendizone)、ブタフェ

ナシル (butafenacil)、メトベンズロン (metobenzuron)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、フルポキサム (flupoxam)、フルアゾレート (fluazolate)、プロフルアゾール (proflumazone)、ピラクロニル (pyrachlonil) などのように植物のクロロフィル生合成を阻害し、光増感過酸化物質を植物体中に異常蓄積させることで除草効力を示すとされているもの。

(5) ノルフルラゾン (norflurazon)、メトフルラゾン (metflurazon) のようなピリダジノン系、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ベンゾフェナップ (benzofenap) のようなピラゾール系、その他アミトロール (amitrol)、フルリドン (fluridone)、フルルタモン (flurtamone)、ジフルフェニカン (diflufenican)、メトキシフェノン (methoxyphenone)、クロマゾン (clomazone)、スルコトリオン (sulcotrione)、メソトリオン (mesotrione)、イソキサフルトール (isoxaflutole)、ジフェンゾコート (difenzoquat)、イソキサクロロトール (isoxachlortole)、ベンゾビシクロン (benzobicyclone)、ピコリノフェン (picolinofen)、ビフルブタミド (beflubutamid) などのようにカロチノイドなどの植物の色素生合成を阻害し、白化作用を特徴とする除草効力を示すとされているもの。

(6) ジクロホップメチル (diclofop-methyl)、フラムプロップエムメチル (flamprop-M-methyl)、ピリフェノップナトリウム塩 (pyriphenop-sodium)、フルアジホップブチル (fluazifop-butyl)、ハロキシホップメチル (haloxyfop-methyl)、キザロホップエチル (quizalofop-ethyl)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl)、フェノキサプロップエチル (fenoxaprop-ethyl) のようなアリールオキシフェノキシプロピオン酸系、アロキシジムナトリウム塩 (alloxydim-sodium)、クレソジ

ム (c l e t h o d i m)、セトキシジム (s e t h o x y d i m)、トラルコキシジム (t r a l k o x y d i m)、ブトロキシジム (b u t r o x y d i m)、テプラロキシジム (t e p r a l o x y d i m)、カロキシジム (c a l o x y d i m)、クレフォキシジム (c l e f o x y d i m) のようなシクロヘキサンジオン系などのようにイネ科植物に特異的に除草効力が強く認められるもの。

(7) クロリムロンエチル (c h l o r i m u r o n - e t h y l)、スルホメツロンメチル (s u l f o m e t u r o n - m e t h y l)、プリミスルフロンのメチル (p r i m i s u l f u r o n - m e t h y l)、ベンスルフロンのメチル (b e n s u l f u r o n - m e t h y l)、クロルスルフロンの (c h l o r s u l f u r o n)、メトスルフロンのメチル (m e t s u l f u r o n - m e t h y l)、シノスルフロンの (c i n o s u l f u r o n)、ピラゾスルフロンのエチル (p y r a z o s u l f u r o n - e t h y l)、アジムスルフロンの (a z i m s u l f u r o n)、フラザスルフロンの (f l a z a s u l f u r o n)、リムスルフロンの (r i m s u l f u r o n)、ニコスルフロンの (n i c o s u l f u r o n)、イマゾスルフロンの (i m a z o s u l f u r o n)、シクロスルファミロンの (c y c l o s u l f a m u r o n)、プロスルフロンの (p r o s u l f u r o n)、フルピルスルフロンの (f l u p y r s u l f u r o n)、トリスルフロンのメチル (t r i s u l f u r o n - m e t h y l)、ハロスルフロンのメチル (h a l o s u l f u r o n - m e t h y l)、チフェンスルフロンのメチル (t h i f e n s u l f u r o n - m e t h y l)、エトキシスルフロンの (e t h o x y s u l f u r o n)、オキサスルフロンの (o x a s u l f u r o n)、エタメトスルフロンの (e t h a m e t s u l f u r o n)、フルピルスルフロンの (f l u p y r s u l f u r o n)、イオドスルフロンの (i o d o s u l f u r o n)、スルフォスルフロンの (s u l f o s u l f u r o n)、トリトスルフロンの (t r i t o s u l f u r o n)、フォーラムスルフロンの (f o r a m s u l f u r o n)、トリフルオキシスルフロンの (t r i f l o x y s u l f u r o n) のようなスルホニルウレア系、フルメツラム (f l u m e t s u l a m)、

メトスラム (metosulam)、ジクロスラム (diclosulam)、クロランスラムメチル (cloransulam-methyl)、フロラスラム (florasulam)、メトスルファム (metosulfam)、ペノクスラム (penoxsulam) のようなトリアゾロピリミジンスルホンアミド系、イマザピル (imazapyr)、イマゼタピル (imazethapyr)、イマザキン (imazaquin)、イマザモックス (imazamox)、イマザメス (imazameth)、イマザメタベンズ (imazamethabenz)、イマザピック (imazapic) のようなイミダゾリノン系、ピリチオバックナトリウム塩 (pyrithiobac-sodium)、ビスピリバックナトリウム塩 (bispiribac-sodium)、ピリミノバックメチル (pyriminobac-methyl)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim)、ピリフタリド (pyriftalid) のようなピリミジニルサリチル酸系、フルカーバゾン (flucarbazone)、プロカーバゾンソディウム (procarbazone-sodium) のようなスルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系、その他グリホサートアンモニウム塩 (glyphosate-ammonium)、グリホサートイソプロピルアミン塩 (glyphosate-isopropyl amine)、グルホシネートアンモニウム塩 (glufosinate-ammonium)、ビアラホス (bialaphos) などのように植物のアミノ酸生合成を阻害することで除草効力を示すとされているもの。

(8) トリフルラリン (trifluralin)、オリザリン (oryzalin)、ニトラリン (nitralin)、ペンディメタリン (pendimethalin)、エタルフルラリン (ethalfluralin) のようなジニトロアニリン系、アミプロホスメチル (amiprofos-methyl)、ブタミホス (butamifos)、アニロホス (anilofos)、ピペロホス (piperophos) のような有機リン系、クロルプロファム (chlorpropham)、バーバン (barban) のようなフェニルカーバメート系、ダイムロン (daimuron)、クミルロン (cumyluron

）、ブロモブチド (bromobutide) のようなクミルアミン系、その他アシュラム (asulam)、ジチオピル (dithiopyr)、チアゾピル (thiazopyr) などのように植物の細胞有糸分裂を阻害することで除草効力を示すとされているもの。

(9) EPTC、ブチレート (butylate)、モリネート (molinate)、ジメピペレート (dimepiperate)、フルアゾレート (fluazolate)、エスプロカルブ (esprocarb)、チオベンカルブ (thiobencarb)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、トリアレート (triallate) のようなチオカーバメート系、アラクロール (alachlor)、ブタクロール (butachlor)、プレチラクロール (pretilachlor)、メトラクロール (metolachlor)、S-メトラクロール (S-metolachlor)、テニルクロール (thenylchlor)、ペトキサマイド (pethoxamid)、ジメテナミド (dimethenamid)、アセトクロール (acetochlor)、プロパクロール (propachlor) のようなクロロアセトアミド系、その他エトベンザニド (etobenzanid)、メフェナセット (mefenacet)、フルフェナセット (flufenacet)、トリディファン (tridiphan)、カフェンストロール (cafenstrole)、フェントラザミド (fentrazamide)、オキサジクロメフォン (oxaziclomefone)、インダノファン (indanofan) などのように植物のタンパク質生合成あるいは脂質生合成を阻害することで除草効力を示すとされているもの。

(10) *Xanthomonas campestris*, *Epicoccossurus nematosurus*, *Exserohilum monoseras*, *Drechsrela monoceras* などのように植物に寄生することで除草効力を示すとされているもの。

また本発明化合物は後記試験例に見られるとおり、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネなどの作物に対し安全性を有し、且つ、雑草を良好に防除できる選択

性を示すものを含むが、本発明化合物を前記作物栽培において使用する際、前記他の除草剤の有効成分化合物中、例えば次のごとき化合物の1種または2種以上と混用或は併用すれば相乗効果が得られることがある。

イネの栽培； 2， 4-D、MCPA、MCPB、ナプロアニリド、ジクロベニル、キンクロラック、シメトリン、プロメトリン、ジメタメトリン、プロパニル、スエップ、ベンタゾン、ニトロフェン、クロメトキシフェン、ビフェノックス、オキサジアルギル、オキサジアゾン、スルフエントラゾン、カーフェントラゾンエチル、ペントキサゾン、ピラゾレート、ピラゾキシフェン、ベンゾフェナップ、メトキシフェノン、シハロホップブチル、ベンスルフロンメチル、シノスルフロン、ピラゾスルフロンエチル、アジムスルフロン、イマゾスルフロン、シクロスルフアムロン、エトキシスルフロン、ペノクススラム、ビスピリバックナトリウム塩、ピリミノバックメチル、アニロホス、ピペロホス、ダイムロン、クミルロン、ブロモブチド、ジチオピル、モリネート、ジメピペレート、エスプロカルブ、チオベンカルブ、ピリブチカルブ、テニルクロール、プレチラクロール、ブタクロール、エトベンザニド、メフェナセット、フルフェナセット、カフェンストロール、フェントラザミド、オキサジクロメフォン、インダノファン、ベンゾビシクロン、ピリベンゾキシム、トリアジフラム、クレフォキシジム、ピラクロニル、ピリフタリド

ダイズの栽培； 2， 4-D、リニュロン、メトリブジン、シアナジン、ベンタゾン、パラコート、アシフルオルフェンナトリウム塩、ホメサフェン、ラクトフェン、エトキシフェンエチル、フルミクロラックペンチル、フルミオキサジン、フルチアセットメチル、スルフエントラゾン、ノルフルラゾン、クロマゾン、フルアジホップブチル、キザロホップエチル、フェノキサプロップエチル、ハロキシホップメチル、クレソジム、セトキシジム、ブトロキシジム、テブラロキシジム、クロリムロンエチル、チフェンスルフロンメチル、オキサスルフロン、フルメツラム、クロランスラムメチル、ジクロスラム、イマザピル、イマゼタピル、イマザキン、イマザモックス、イマザピック、トリフルラリン、ペンディメタリン、エタルフルラリン、アラクロール、ペトキサマイド、メトラクロール、S-



メトラクロール、アセトクロール、ジメテナミド、フルフェナセツト

トウモロコシの栽培；2，4-D、MCPA、ジカンバ、クロピラリド、ベナゾリン、ダイフルフェンゾピル、ジウロン、リニュロン、メトベンズロン、シマジン、アトラジン、アトラトン、メトリブジン、テルブチラジン、シアナジン、アメトリン、シプロミッド、プロモキシニル、プロモキシニル・オクタノエート、ピリデート、ベンタゾン、パラコート、オキシフルオルフェン、フルミクロラックペンチル、フルチアセツトメチル、フルリドン、スルコトリオン、メソトリオン、イソキサフルトール、カーフェントラゾンエチル、プリミスルフロンメチル、リムスルフロン、ニコスルフロン、プロスルフロン、ハロスルフロンメチル、チフェンスルフロンメチル、フルメツラム、メトスラム、イマゼタピル、グリホサートアンモニウム塩、グリホサートイソプロピルアミン塩、グルホシネートアンモニウム塩、トリフルラリン、ペンディメタリン、EPTC、ブチレート、アラクロール、ペトキサマイド、メトラクロール、S-メトラクロール、アセトクロール、プロバクロール、ジメテナミド、トリディファン、フロラスラム、メトベンズロン、メトスルファン、オキサスルフロン、テブラロキシジム

コムギの栽培；MCPB、ジクロベニル、キンメラック、クロロトルロン、リニュロン、イソプロチュロン、プロメトリン、プロモキシニル、プロモキシニル・オクタノエート、ピリデート、ビフェノックス、カーフェントラゾンエチル、チジアジミン、ピラフルフェンエチル、フルルタモン、ジフルフェニカン、スルコトリオン、ジクロホップメチル、フラムプロップエムエチル、トラルコキシジム、クロルスルフロン、メトスルフロンメチル、プロスルフロン、ハロスルフロンメチル、フルメツラム、メトスラム、ペンディメタリン、バーバン、イマザメタベンズ、シニドンエチル、エトキシフェンエチル、フロラスラム、フルアゾレート、フルボキサム、イオドスルフロン、メトスルファミン、ピリベンゾキシム、スルフォスルフロン、トラルコキシジム、フルカルバゾンソディウム、ピコリノフェン、シクロスルファミン、エトキシスルフロン、イマザモックス

発明を実施するための最良の形態

次に本発明の実施例を記載するが、本発明はこれらに限定されるものではない。まず本発明化合物の合成例を記載する。

合成例1： $\alpha$ -(4-ブロモチオフエン-2-イル)-4-メチルチオピリミジン-5-イルメタノール（後記化合物No. 2-4）の合成

-78℃に冷却した4-メチルチオ-5-ブロモピリミジン4.1gとテトラヒドロフラン30mlとの混合溶液に、窒素雰囲気下でn-ブチルリチウムのヘキサン溶液13ml（濃度1.57mol/l）を徐々に滴下した後、同温度で30分間反応させた。この溶液に、4-ブロモ-2-チオフエンカルボキシアルデヒド4.3gとテトラヒドロフラン7mlとの混合溶液を徐々に滴下した後、同温度で3時間反応させ、液温を室温に戻しながら、さらに12時間反応させた。反応終了後、反応溶液に酢酸エチル及び塩化アンモニウム水溶液を加えて抽出を行った。有機層を水、次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下留去して、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン/酢酸エチル=3/2）で精製して融点123-126℃の目的物（後記化合物No. 2-4）2.9gを得た。

合成例2：1-(4-ブロモチオフエン-2-イル)-1-(4-メチルチオピリミジン-5-イル)メチル N, N-ジメチルカーバメート（後記化合物No. 1-9）の合成

0℃に冷却した $\alpha$ -(4-ブロモチオフエン-2-イル)-4-メチルチオピリミジン-5-イルメタノール（後記化合物No. 2-4）1.5gとテトラヒドロフラン40mlとの混合溶液に、窒素雰囲気下で60%水素化ナトリウム1.34gを少量ずつ投入した後、5分間攪拌し、同温度下、塩化N, N-ジメチルカルバモイル2.6gを徐々に滴下した後、1時間反応させ、液温を室温に戻しながら、さらに12時間反応させた。反応終了後、反応溶液を0℃まで冷却し、酢酸エチル及び塩化アンモニウム水溶液を加えてしばらく攪拌した後、抽出を行った。有機層を水、次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。

溶媒を減圧下留去して、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン/酢酸エチル＝3/2）で精製して融点110-112℃の目的物（後記化合物No. 1-9）1.2gを得た。

合成例3： $\alpha$ -(5-クロロ-1, 3-ベンゾジオキサラン-4-イル)-4-メチルチオピリミジン-5-イルメタノール（後記化合物No. 2-22）

(1) -40℃に冷却した粗製の5-クロロ-1, 3-ベンゾジオキサール36gとテトラヒドロフラン300mlとの混合溶液に、窒素雰囲気下でn-ブチルリチウムのヘキサン溶液150ml（濃度1.6mol/l）を徐々に滴下した後、同温度で1時間反応させた。この溶液を-60℃まで冷却し、無水N, N-ジメチルホルムアミド17.5gを徐々に滴下した後、同温度で1時間反応させ、液温を室温に戻しながら、さらに2時間反応させた。反応終了後、酢酸エチル及び塩化アンモニウム水溶液を加えて抽出を行った。有機層を水、次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下留去して得た粗製の固体をn-ヘキサン100mlを用いてよく粉碎し、ろ過後吸引乾燥して2-クロロ-5, 6-メチレンジオキシベンズアルデヒド20.9gを得た。

(2) 合成例1と同様にして、4-メチルチオ-5-ブromoピリミジン1.03g、n-ブチルリチウムのヘキサン溶液3.3ml（濃度1.57mol/l）及び2-クロロ-5, 6-メチレンジオキシベンズアルデヒド0.92gを用いて反応させ、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン/酢酸エチル＝1/1）で精製して融点118-120℃の目的物（後記化合物No. 2-22）0.68gを得た。

合成例4：1-(5-クロロ-1, 3-ベンゾジオキサラン-4-イル)-1-(4-メチルチオピリミジン-5-イル)メチル N, N-ジメチルカーバメート（後記化合物No. 1-74）の合成

合成例2と同様にして、 $\alpha$ -(5-クロロ-1, 3-ベンゾジオキサラン-4-イル)-4-メチルチオピリミジン-5-イルメタノール（後記化合物No. 2

－22) 0.34g、60%水素化ナトリウム0.31g及び塩化N,N-ジメチルカルバモイル0.59gを用いて反応させ、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン/酢酸エチル＝1/1）で精製して融点145－147℃の目的物（後記化合物No. 1-74）0.4gを得た。

合成例5： $\alpha$ －（2-クロロチオフェン-3-イル）－4-メチルチオピリミジン-5-イルメタノール（後記化合物No. 2-10）の光学異性体2種（後記化合物No. 2-39及び2-40）の合成

合成例1に準じて合成した $\alpha$ －（2-クロロチオフェン-3-イル）－4-メチルチオピリミジン-5-イルメタノール約5mgを、n-ヘキサン/2-プロパノール混合溶媒（40 $\mu$ l/10 $\mu$ l）に溶解させ、ダイセル化学社製キラルカラム（CHIRALCEL. OJ-H；4.6mm $\phi$ ×150mm）を用い、溶離液n-ヘキサン/2-プロパノール＝9/1（1ml/min.）で、2種の光学異性体［カラム保持時間11.8分の後記化合物No. 2-39及び16.7分の後記化合物No. 2-40］をそれぞれ約2mg得、この操作を数回繰り返した。

得られた各光学異性体の比旋光度 $[\alpha]_D^{25}$ は各々－131.4（No. 2-39）及び＋128.1（No. 2-40）であり、各光学異性体の融点は双方とも110－114℃であった。

合成例6：1－（2-クロロチオフェン-3-イル）－1－（4-メチルチオピリミジン-5-イル）メチル N,N-ジメチルカーバメート（後記化合物No. 1-56）の光学異性体2種（後記化合物No. 1-136及び1-137）の合成

(1) 0℃に冷却した $\alpha$ －（2-クロロチオフェン-3-イル）－4-メチルチオピリミジン-5-イルメタノールの光学異性体（後記化合物No. 2-39）55mgとテトラヒドロフラン10mlとの混合溶液に、窒素雰囲気下で60%水素化ナトリウム24mgを少量ずつ投入した後、5分間攪拌し、同温度下、塩化N,N-ジメチルカルバモイル43mgを徐々に滴下した後1時間反応させ、液温を

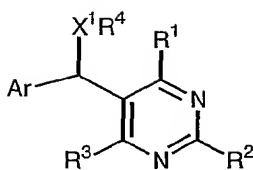
室温に戻しながら、さらに12時間反応させた。反応終了後、反応溶液を0℃まで冷却し、酢酸エチルおよび塩化アンモニウム水溶液を加えてしばらく攪拌した後、抽出を行った。有機層を水、次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下留去して、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン/酢酸エチル=3/2）で精製して目的物（後記化合物No. 1-136）50mgを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

<sup>1</sup>H-NMR [400MHz, CDCl<sub>3</sub>, TMS, δ (ppm)]

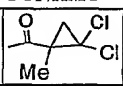
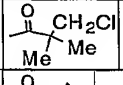
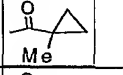
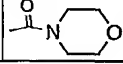
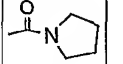
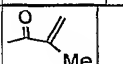
2.50 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 2.93 (s, 3H), 6.79 (d, 1H; J=5.6Hz),  
6.85 (s, 1H), 7.02 (d, 1H; J=5.6Hz), 8.39 (s, 1H), 8.82 (s, 1H)

(2) α-(2-クロロチオフェン-3-イル)-4-メチルチオピリミジン-5-イルメタノールの光学異性体（後記化合物No. 2-40）を用い、上記(1)と同様にして、目的物（後記化合物No. 1-137）50mgを得た。このもののNMRスペクトルデータは、化合物No. 1-136と同じである。

次に、前記式(I)で表される本発明化合物の代表例を第1表および第2表に挙げるが、これら化合物は前記合成例或は前記した本発明化合物の種々の製造方法に基づいて製造することができる。尚、表中でMeはメチル基を、Etはエチル基を、Pr(n)はノルマルプロピル基を、Pr(i)はイソプロピル基を、Pr(Cy)はシクロプロピル基を、Bu(i)はイソブチル基を、Bu(t)はターシャリーブチル基を、Phはフェニル基を各々表す。また、表中で3-Cl-チオフェン-2-イルとあるのは、3位にCl（塩素原子）が置換したチオフェン-2-イル基を表し、4-SMe-チオフェン-2-イルとあるのは、4位にSMe（メチルチオ基）が置換したチオフェン-2-イル基を表し、2-(4-CF<sub>3</sub>-SPh)-チオフェン-3-イルとあるのは、2位に4-CF<sub>3</sub>-SPh（4位にCF<sub>3</sub>基が置換したフェニルチオ基）が置換したチオフェン-3-イル基を表す（他の同様の記載もこれらに準じる）。



第1表

化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:℃)
1-1	3-Cl-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	100-101
1-2	3-Cl-チオフエン-2-イル	O	SEt	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-3	3-Cl-チオフエン-2-イル	O	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-4	3-Cl-チオフエン-2-イル	O	OMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-5	3-Cl-チオフエン-2-イル	S	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-6	4-Cl-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-7	5-Cl-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	110-112
1-8	3-Br-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	89-95
1-9	4-Br-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	110-112
1-10	4-Br-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONHMe	180-183
1-11	4-Br-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H		オイル
1-12	4-Br-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CSNMe <sub>2</sub>	オイル
1-13	4-Br-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H		オイル
1-14	4-Br-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H		100-103
1-15	4-Br-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H		オイル
1-16	4-Br-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	COSMe	オイル
1-17	4-Br-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H		124-125
1-18	4-Br-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H		

第1表 (続き)

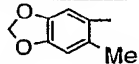
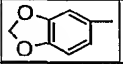
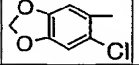
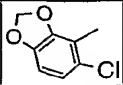
化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点: °C)
1-19	4-Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H		
1-20	4-Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H		
1-21	4-Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H		
1-22	4-Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H		
1-23	4-Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H		
1-24	4-Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H		
1-25	4-Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CH <sub>2</sub> CN	
1-26	4-Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H		
1-27	4-Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	Pr (Cy)	
1-28	4-Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	Pr (i)	
1-29	5-Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	121-125
1-30	3-F-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-31	3-F-チオフエン-2-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-32	4-F-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-33	5-F-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-34	4-I-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-35	3-Me-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	80-85
1-36	4-Me-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-37	5-Me-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	98-99
1-38	3-CF <sub>3</sub> -チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-39	3-CF <sub>3</sub> -チオフエン-2-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	

第1表 (続き)

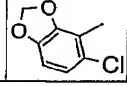
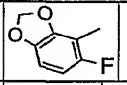
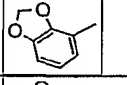
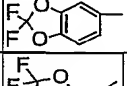
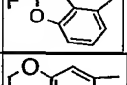
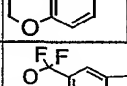
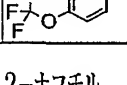
化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点: °C)
1-40	4-CF <sub>3</sub> -チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	80-82
1-41	5-CF <sub>3</sub> -チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-42	3-CH <sub>2</sub> Cl-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-43	3-CH <sub>2</sub> Br-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-44	3-CH <sub>2</sub> F-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-45	4-SMe-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-46	4-OMe-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-47	4, 5-Cl <sub>2</sub> -チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-48	3, 5-Cl <sub>2</sub> -チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-49	チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	75-80
1-50	チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	91-98
1-51	4-Br-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	92-93
1-52	4-Br-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONHMe	
1-53	4-Br-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONHEt	
1-54	4-Br-チオフエン-3-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-55	4-Br-チオフエン-3-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONHMe	
1-56	2-Cl-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	81-83
1-57	2-Cl-チオフエン-3-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-58	2, 5-Cl <sub>2</sub> -チオフエン-3-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-59	5-Br-フラン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-60	5-NO <sub>2</sub> -フラン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-61	2-SMe-チアゾール-5-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル



第1表 (続き)

化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:°C)
1-62	2-C1-チアゾール-5-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-63	5-C1-3-CF <sub>3</sub> -ヒ°ラゾール-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-64	3-CF <sub>3</sub> -ヒ°ラゾール-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-65	5-C1-3-Pr (Cy) -1-Me-ヒ°ラゾール-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	146-147
1-66	3-Pr (Cy) -1-Me-ヒ°ラゾール-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	82-85
1-67	5-C1-1, 3-Me <sub>2</sub> -ヒ°ラゾール-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	81-90
1-68	5-C1-1-Me-ヒ°ラゾール-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	141. 4
1-69	5-C1-3-CH <sub>2</sub> F-1-Me-ヒ°ラゾール-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-70		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	88-93
1-71		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	>310
1-72		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	54-59
1-73	同上	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-74		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	145-147
1-75	同上	0	SMe	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	
1-76	同上	0	SMe	H	H	CONHMe	
1-77	同上	0	SMe	H	H	CO-Pr (i)	

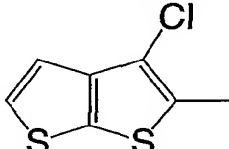
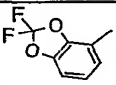
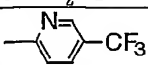
第1表 (続き)

化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:℃)
1-78		0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	127-129
1-79	同上	0	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-80	同上	0	CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-81	同上	0	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-82	同上	0	Me	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-83	同上	0	Et	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-84	同上	0	Pr (i)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-85	同上	0	Ph	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-86		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-87		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-88		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-89		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-90		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-91		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-92	2-ナフチル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-93	1-ナフチル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	126-128
1-94	ベンゾチオフェン-6-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-95	ベンゾフラン-6-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-96	インドール-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-97	インドール-1-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-98	インドール-1-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	

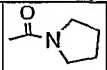
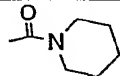
第1表 (続き)

化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:℃)
1-99	ヘンゾチオフェン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	122-123
1-100	5-Cl-1-Me-3-CF <sub>3</sub> -ヒラゾール-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	135. 6
1-101	1-Me-3-CF <sub>3</sub> -ヒラゾール-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-102	5-OEt-1-Me-3-CF <sub>3</sub> -ヒラゾール-4-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	104. 2
1-103	1-Me-3-CF <sub>3</sub> -ヒラゾール-4-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-104	5-SMe-1-Me-ヒラゾール-4-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-105	5-OEt-3-Cl-1-Me-ヒラゾール-4-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	99. 8
1-106	3-Br-チオフェン-2-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-107	5-Br-チオフェン-2-イル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-108	3, 5-Cl <sub>2</sub> -1-Me-ヒラゾール-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-109	5-Cl-1, 3-Me <sub>2</sub> -ヒラゾール-4-イル	0	SMe	H	H	CONHMe	143-146
1-110	5-Cl-チオフェン-3-イル	0	SMe	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	オイル
1-111	4-Br-チオフェン-3-イル	0	SMe	H	H	CONEt <sub>2</sub>	
1-112	2-Cl-チオフェン-3-イル	0	SMe	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	オイル

第1表 (続き)

化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:℃)
1-113	4, 5-Cl <sub>2</sub> -チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	111-112
1-114	5-Br-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-115	4, 5-Cl <sub>2</sub> -チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	
1-116	4, 5-Br <sub>2</sub> -チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-117	6-Cl-1, 2, 3, 4-テトラヒド ロナフタレン-7-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-118	6-Cl-インダ ン-5-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-119	6-Cl-ジ ヒド ロベ ンゾ フラ ン-5-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-120		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-121		0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	97-98
1-122	5-Cl-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	93-94
1-123	4-Br-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	オイル
1-124	4-Br-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONHMe	オイル
1-125	2, 5-Cl <sub>2</sub> -チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	78-81
1-126	キノリン-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	126-126. 5
1-127	2-Cl-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	COCH <sub>2</sub> Cl	オイル
1-128	2-Cl-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H		84-87
1-129	2-CN-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-130	2, 4-Cl <sub>2</sub> -チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	35-45

第1表 (続き)

化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:℃)
1-131	イソキノリン-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	157-160
1-132	イソキノリン-4-イル	0	CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	84-86
1-133	1-C1-イソキノリン-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	129-132
1-134	4-Br-チオフエン-3-イル	0	CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	114-115
1-135	2-CF <sub>3</sub> -チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-136	2-C1-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	光学異性体
1-137	2-C1-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	光学異性体
1-138	2-C1-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONEt <sub>2</sub>	オイル
1-139	2-C1-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CON (Me) Et	49-52
1-140	1-ナフチル	0	SMe	H	H	CON (Me) Et	134-136
1-141	1-ナフチル	0	SMe	H	H	CONEt <sub>2</sub>	105-108
1-142	1-ナフチル	0	SMe	H	H		145-149
1-143	1-ナフチル	0	SMe	H	H		145-147
1-144	1-ナフチル	0	SMe	H	H	CSNMe <sub>2</sub>	173-183
1-145	1-ナフチル	0	Pr (Cy)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	157-158
1-146	2-ナフチル	0	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-147	1-ナフチル	0	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-148	1-ナフチル	0	CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-149	1-ナフチル	0	SMe	H	SMe	CONMe <sub>2</sub>	70-72
1-150	1-ナフチル	0	SMe	H	CF <sub>3</sub>	CONMe <sub>2</sub>	53-54
1-151	2-ナフチル	0	SMe	H	CF <sub>3</sub>	CONMe <sub>2</sub>	オイル

第1表 (続き)

化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:℃)
1-152	2-ナフチル	0	Cl	H	Cl	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-153	2-Me-1-ナフチル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	50-51
1-154	4-Cl-1-ナフチル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	108-110
1-155	2-OMe-1-ナフチル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	200-201
1-156	2-OMe-1-ナフチル	0	OMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	179-180
1-157	4-Cl-1-ナフチル	0	OMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-158	2-Cl-1-ナフチル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	58-59
1-159	7-Cl-1-ナフチル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	166-168
1-160	6-Cl-1-ナフチル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	155-157
1-161	4-Cl-1-ナフチル	0	CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	118-119
1-162	1-ナフチル	0	CF <sub>2</sub> H	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-163	4-F-1-ナフチル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-164	2-ナフチル	0	CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-165	2-SMe-1-ナフチル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	155-156
1-166	1-ナフチル	0	OMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	145-147
1-167	1-ナフチル	0	OE <sub>t</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-168	1-ナフチル	0	NMe <sub>2</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	132-133
1-169	1-ナフチル	0	O-Pr (i)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-170	1-ナフチル	0	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	オイル
1-171	1-ナフチル	0	CF <sub>3</sub>	H	H	CONEt <sub>2</sub>	オイル
1-172	1-ナフチル	0	O-Pr (n)	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-173	1-ナフチル	0	OE <sub>t</sub>	H	H	CONEt <sub>2</sub>	オイル

第1表 (続き)

化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:°C)
1-174	1-ナフチル	0	OEt	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	オイル
1-175	1-ナフチル	0	SEt	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-176	1-ナフチル	0	SEt	H	H	CONEt <sub>2</sub>	オイル
1-177	1-ナフチル	0	SEt	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	オイル
1-178	1-ナフチル	0	SCF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-179	1-ナフチル	0	SCHF <sub>2</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-180	1-ナフチル	0	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-181	1-ナフチル	0	OCHF <sub>2</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-182	1-ナフチル	0	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-183	インダ ン-4-イル	0	SCF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-184	インダ ン-4-イル	0	SCHF <sub>2</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-185	インダ ン-4-イル	0	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-186	インダ ン-4-イル	0	OCHF <sub>2</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-187	インダ ン-4-イル	0	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-188	ベンゾ チオフェン-3-イル	0	SCF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-189	ベンゾ チオフェン-3-イル	0	SCHF <sub>2</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-190	ベンゾ チオフェン-3-イル	0	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-191	ベンゾ チオフェン-3-イル	0	OCHF <sub>2</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-192	ベンゾ チオフェン-3-イル	0	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-193	2-C1-チオフェン-3-イル	0	SCF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-194	2-C1-チオフェン-3-イル	0	SCHF <sub>2</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-195	2-C1-チオフェン-3-イル	0	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	

第1表 (続き)

化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:℃)
1-196	2-Cl-チオフエン-3-イル	0	OCHF <sub>2</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-197	2-Cl-チオフエン-3-イル	0	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	
1-198	1, 2, 3, 4-テトラヒド <sup>*</sup> ロナフタレ ン-6-イル	0	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-199	5-Me-1, 4-ベンゾ <sup>*</sup> ジ オキサ ラン-6-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	180
1-200	6-Me-1, 4-ベンゾ <sup>*</sup> ジ オキサ ラン-7-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-201	1, 4-ベンゾ <sup>*</sup> ジ オキサラン-5- イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-202	1, 2, 3, 4-テトラヒド <sup>*</sup> ロナフタレ ン-6-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-203	ジヒド <sup>*</sup> ロベンゾ <sup>*</sup> フラン-5-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-204	1, 2, 3, 4-テトラヒド <sup>*</sup> ロナフタレ ン-5-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-205	ジヒド <sup>*</sup> ロベンゾ <sup>*</sup> フラン-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-206	インダ <sup>*</sup> ン-5-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-207	インダ <sup>*</sup> ン-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-208	ベンゾ <sup>*</sup> チオフエン-5-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-209	1, 2, 3, 4-テトラヒド <sup>*</sup> ロナフタレ ン-6-イル	0	CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-210	7-Bu (t)-1, 2, 3, 4-テトラ ヒド <sup>*</sup> ロナフタレン-5-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル



第1表 (続き)

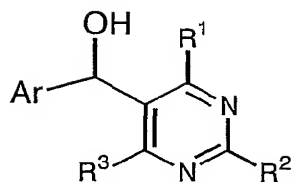
化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:℃)
1-211	6-Bu (t) -インダ ン-4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-212	6-Bu (t) -インダ ン-5-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-213	ナフタレン-1-イル	0	CF <sub>3</sub>	Me	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-214	インダ ン-4-イル	0	CF <sub>3</sub>	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-215	インダ ン-4-イル	0	CF <sub>3</sub>	H	H	COCH <sub>2</sub> Ph	オイル
1-216	5-Cl-1-Me-3-CF <sub>3</sub> -ピラ ゾ ール-4-イル	0	SMe	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	オイル
1-217	5-Ph-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-218	3-Cl-ベンゾ チオフエン-2-イ ル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	126. 6
1-219	3-Cl-ベンゾ フラン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	105. 9
1-220	5-Ph-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	140. 8
1-221	5-SMe-チオフエン-2-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	94. 8
1-222	2-SMe-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	130. 4
1-223	2-SBu (t) -チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	105. 7
1-224	2-CHF <sub>2</sub> -チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-225	2-Cl-ベンゾ チオフエン-3-イ ル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	128. 8
1-226	2-SPh-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-227	2-(ピリジ ン-2-イルチオ)-チ オフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-228	2-Ph-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル

第1表 (続き)

化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:℃)
1-229	2-(4-CF <sub>3</sub> -SPh)-チオフエ ン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-230	2-(4-Cl-SPh)-チオフエン- 3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-231	2-(2-Cl-SPh)-チオフエン- 3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-232	2-(4-Me-SPh)-チオフエン- 3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-233	4-Ph-チオフエン-3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	101-102
1-234	2-(2-Cl-Ph)-チオフエン- 3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-235	2-(4-Cl-Ph)-チオフエン- 3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-236	2-(2-OMe-Ph)-チオフエン- 3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	無定形固体
1-237	2-(2-CF <sub>3</sub> -Ph)-チオフエン- 3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	無定形固体
1-238	3-(2-Cl-Ph)-チオフエン- 4-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	無定形固体
1-239	2-(2-Me-Ph)-チオフエン- 3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	無定形固体
1-240	2-(3-NO <sub>2</sub> -Ph)-チオフエン- 3-イル	0	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	無定形固体

第1表 (続き)

化合物 No.	A r	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性 (融点:℃)
1-241	2-(3-Cl-Ph)-チオフエン-3-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	無定形固体
1-242	2-エチルチオフエン-3-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-243	2-Cl-チオフエン-3-イル	S	SMe	H	H	Pr (i)	オイル
1-244	2-SPr (i)-チオフエン-3-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-245	2-シクロペンチルチオチオフエン-3-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-246	2-Cl-チオフエン-3-イル	S	SMe	H	H	Bu (i)	オイル
1-247	2-Cl-チオフエン-3-イル	O	SMe	H	H	Bu (i)	69. 1
1-248	2-Cl-チオフエン-3-イル	O	SMe	H	H	Pr (i)	82. 7
1-249	2-SCF <sub>3</sub> -チオフエン-3-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-250	2-Cl-チオフエン-3-イル	O	SMe	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> NMe <sub>2</sub>	オイル
1-251	3-(1, 3-ジオキサラン-2-イル)-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-252	3-Br-ペンチルチオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	オイル
1-253	3-(1, 3-ジチアン-2-イル)-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	155. 2
1-254	3-(1, 3-ジオキサン-2-イル)-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	102. 1
1-255	3-(4-Me-1, 3-ジオキサラン-2-イル)-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	無定形結晶
1-256	3-(1, 3-オキサチオラン-2-イル)-チオフエン-2-イル	O	SMe	H	H	CONMe <sub>2</sub>	108. 8

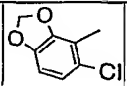
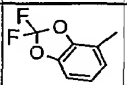


第2表

(I - 1)

化合物 No.	A r	$R^1$	$R^2$	$R^3$	物性 (融点: °C)
2-1	3-Cl-チオフエン-2-イル	SMe	H	H	138-143
2-2	4-Cl-チオフエン-2-イル	SMe	H	H	108-110
2-3	5-Cl-チオフエン-2-イル	SMe	H	H	137-146
2-4	4-Br-チオフエン-2-イル	SMe	H	H	123-126
2-5	5-Br-チオフエン-2-イル	SMe	H	H	145-150
2-6	3-Me-チオフエン-2-イル	SMe	H	H	オイル
2-7	5-Me-チオフエン-2-イル	SMe	H	H	156-158
2-8	4-CF <sub>3</sub> -チオフエン-2-イル	SMe	H	H	113-116
2-9	3-OMe-チオフエン-2-イル	SMe	H	H	148-154
2-10	2-Cl-チオフエン-3-イル	SMe	H	H	124-130
2-11	5-Cl-3-Pr (Cy) -1-Me-ヒラゾール-4-イル	SMe	H	H	150-152
2-12		SMe	H	H	80-83
2-13		SMe	H	H	156-159
2-14		Pr (Cy)	H	H	164-165
2-15		Pr (Cy)	H	H	146-148
2-16		SMe	H	H	141-143
2-17		SMe	H	H	140-141

第2表 (続き)

化合物 No.	A r	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性 (融点:℃)
2-18	2-ナフチル	SMe	H	H	138-146
2-19	1-ナフチル	SMe	H	H	178-181
2-20	ベンゾチオフェン-3-イル	SMe	H	H	184-186
2-21	3, 5-Cl <sub>2</sub> -1-Me-ピラゾール-4-イル	SMe	H	H	153. 4
2-22		SMe	H	H	118-120
2-23		SMe	H	H	147-152
2-24	4, 5-Cl <sub>2</sub> -チオフェン-3-イル	SMe	H	H	146-153
2-25	5-Cl-チオフェン-3-イル	SMe	H	H	
2-26	4-Br-チオフェン-3-イル	SMe	H	H	
2-27	5-CF <sub>3</sub> -チオフェン-3-イル	SMe	H	H	94-100
2-28	キノリン-4-イル	SMe	H	H	192-197
2-29	1-Me-インドール-3-イル	SMe	H	H	138-143
2-30	2-CN-チオフェン-3-イル	SMe	H	H	オイル
2-31	2, 4-Cl <sub>2</sub> -チオフェン-3-イル	SMe	H	H	155-158
2-32	イソキノリン-4-イル	SMe	H	H	162-185
2-33	イソキノリン-4-イル	CF <sub>3</sub>	H	H	オイル
2-34	1-Cl-イソキノリン-4-イル	SMe	H	H	135-150
2-35	4-Br-チオフェン-3-イル	CF <sub>3</sub>	H	H	70-72
2-36	2-CF <sub>3</sub> -チオフェン-3-イル	SMe	H	H	110-117
2-37	2, 5-Cl <sub>2</sub> -チオフェン-3-イル	CF <sub>3</sub>	H	H	80-86
2-38	2, 5-Cl <sub>2</sub> -チオフェン-3-イル	SMe	H	H	136-144

第2表 (続き)

化合物 No.	A r	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性 (融点:℃)
2-39	2-Cl-チオフエン-3-イル	SMe	H	H	光学異性体
2-40	2-Cl-チオフエン-3-イル	SMe	H	H	光学異性体
2-41	1-ナフチル	Pr (Cy)	H	H	202-203
2-42	2-ナフチル	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	オイル
2-43	1-ナフチル	CF <sub>3</sub>	H	H	オイル
2-44	1-ナフチル	Cl	H	Cl	140-141
2-45	2-ナフチル	Cl	H	Cl	119-120
2-46	1-ナフチル	SMe	H	CF <sub>3</sub>	93-95
2-47	2-ナフチル	SMe	H	CF <sub>3</sub>	オイル
2-48	2-Me-1-ナフチル	SMe	H	H	196-197
2-49	4-Cl-1-ナフチル	SMe	H	H	206-207
2-50	2-OMe-1-ナフチル	SMe	H	H	180-181
2-51	2-OMe-1-ナフチル	OMe	H	H	164-166
2-52	7-Cl-1-ナフチル	SMe	H	H	174-176
2-53	2-Cl-1-ナフチル	SMe	H	H	200-201
2-54	6-Cl-1-ナフチル	SMe	H	H	193-194
2-55	4-Cl-1-ナフチル	CF <sub>3</sub>	H	H	150-151
2-56	1-ナフチル	CF <sub>2</sub> H	H	H	オイル
2-57	4-F-1-ナフチル	SMe	H	H	199-200
2-58	2-ナフチル	CF <sub>3</sub>	H	H	オイル
2-59	2-SMe-1-ナフチル	SMe	H	H	179-180
2-60	1-ナフチル	OMe	H	H	155-157

第2表 (続き)

化合物 No.	A r	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性 (融点:℃)
2-61	1-ナフチル	OEt	H	H	100-102
2-62	1-ナフチル	NMe <sub>2</sub>	H	H	167-169
2-63	1-ナフチル	O-Pr (i)	H	H	127-129
2-64	1-ナフチル	O-Pr (n)	H	H	84-85
2-65	1-ナフチル	SEt	H	H	105-107
2-66	4-Cl-1-ナフチル	OMe	H	H	181-183
2-67	1-ナフチル	SCF <sub>3</sub>	H	H	
2-68	1-ナフチル	SCHF <sub>2</sub>	H	H	
2-69	1-ナフチル	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	
2-70	1-ナフチル	OCHF <sub>2</sub>	H	H	
2-71	1-ナフチル	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	
2-72	インダン-4-イル	SCF <sub>3</sub>	H	H	
2-73	インダン-4-イル	SCHF <sub>2</sub>	H	H	
2-74	インダン-4-イル	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	
2-75	インダン-4-イル	OCHF <sub>2</sub>	H	H	
2-76	インダン-4-イル	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	
2-77	ベンゾチオフェン-3-イル	SCF <sub>3</sub>	H	H	
2-78	ベンゾチオフェン-3-イル	SCHF <sub>2</sub>	H	H	
2-79	ベンゾチオフェン-3-イル	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	
2-80	ベンゾチオフェン-3-イル	OCHF <sub>2</sub>	H	H	
2-81	ベンゾチオフェン-3-イル	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	
2-82	2-Cl-チオフェン-3-イル	SCF <sub>3</sub>	H	H	

第2表 (続き)

化合物 No.	A r	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性 (融点:℃)
2-83	2-C1-チオフエン-3-イル	SCHF <sub>2</sub>	H	H	
2-84	2-C1-チオフエン-3-イル	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	
2-85	2-C1-チオフエン-3-イル	OCHF <sub>2</sub>	H	H	
2-86	2-C1-チオフエン-3-イル	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	
2-87	1, 4-ヘンゾジ オキサラン-6-イル	SMe	H	H	オイル
2-88	1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	オイル
2-89	5-Me-1, 4-ヘンゾジ オキサラン-6-イル	SMe	H	H	193
2-90	6-Me-1, 4-ヘンゾジ オキサラン-7-イル	SMe	H	H	158
2-91	1, 4-ヘンゾジ オキサラン-5-イル	SMe	H	H	オイル
2-92	1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル	SMe	H	H	オイル
2-93	ジヒドロベンゾフラン-5-イル	SMe	H	H	オイル
2-94	1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル	SMe	H	H	148
2-95	ジヒドロベンゾフラン-4-イル	SMe	H	H	193
2-96	インダール-5-イル	SMe	H	H	オイル
2-97	インダール-4-イル	SMe	H	H	オイル
2-98	ベンゾチオフエン-5-イル	SMe	H	H	オイル
2-99	1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル	CF <sub>3</sub>	H	H	オイル
2-100	7-Bu (t)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル	SMe	H	H	オイル
2-101	6-Bu (t)-インダール-4-イル	SMe	H	H	オイル
2-102	6-Bu (t)-インダール-5-イル	SMe	H	H	オイル
2-103	ナフタレン-1-イル	CF <sub>3</sub>	Me	H	オイル



第2表 (続き)

化合物 No.	A r	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性 (融点:℃)
2-104	インダ ン-4-イル	CF <sub>3</sub>	H	H	オイル
2-105	5-SMe-チオフエン-2-イル	SMe	H	H	148. 7
2-106	2-SMe-チオフエン-3-イル	SMe	H	H	オイル
2-107	2-SBu (t) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	オイル
2-108	2-SPh-チオフエン-3-イル	SMe	H	H	オイル
2-109	2- (ヒ° リジ° ン-2-イルチオ) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	124. 5
2-110	2- (4-CF <sub>3</sub> -SPh) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	94. 9
2-111	2- (4-Cl-SPh) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	112. 1
2-112	2- (2-Cl-SPh) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	130. 5
2-113	2- (1-ヒ° ペ° リジ° ニル) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	オイル
2-114	2- (4-Me-SPh) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	無定形固体
2-115	2- (2-Cl-Ph) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	オイル
2-116	2- (4-Cl-Ph) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	オイル
2-117	2- (2-OMe-Ph) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	170. 5
2-118	2- (2-CF <sub>3</sub> -Ph) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	147. 5
2-119	2- (2-Me-Ph) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	無定形固体
2-120	2- (3-NO <sub>2</sub> -Ph) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	60. 9
2-121	2- (3-Cl-Ph) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	無定形固体
2-122	2- (2-トリメチルシリルエチル) -チオフエン-3-イ ル	SMe	H	H	無定形固体
2-123	2-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	オイル
2-124	2-Pr (i) -チオフエン-3-イル	SMe	H	H	オイル
2-125	2-シクロヘ° ンチルチオ-チオフエン-3-イル	SMe	H	H	オイル

次に本発明の試験例を記載する。

#### 試験例1

1/170,000ヘクタールポットに畑作土壌をつめ、各種植物の種子を播種した。その後、植物が一定の葉令((1)ノビエ1.8~2.2葉期、(2)メヒシバ1.6~2.5葉期、(3)アオゲイトウ0.1~1.0葉期、(4)アメリカキンゴジカ0.1~1.0葉期、(5)マルバアサガオ0.2~0.8葉期、(6)オナモミ0.2~1.8葉期、(7)イネ1.6~2.0葉期、(8)コムギ2.2~2.7葉期、(9)トウモロコシ2.5~3.0葉期、(10)ダイズ0.1~0.3葉期)に達したとき、本発明化合物を通常の製剤方法に準じて調製した水和剤又は乳剤を所定有効成分量となるように秤量し、1ヘクタール当り500リットルの水に希釈した。更にその希釈液に対して農業用展着剤を0.1容量%加え、小型スプレーで茎葉処理した。

薬剤処理後17~22日目に各種植物の生育状態を肉眼観察し、0(無処理区と同等)~100(完全枯殺)の抑草率(%)で除草効果を評価し、第3表の結果を得た。

。

第3表

化合物 No.	有効成分 量 (g/ha)	抑 草 率 (%)										調 査 日
		ノ ビ エ	メ ヒ シ バ	ア オ ゲ イ ト ウ	ア メ リ カ キ ン ゴ ジ カ	マ ル バ ア サ ガ オ	オ ナ モ ミ	イ ネ	コ ム ギ	ト ウ モ ロ コ シ	ダ イ ズ	
1-1	2000	60	60	80	90	40	80	40	-	0	40	21
	500	0	30	80	50	0	30	0	-	0	0	
1-9	2000	20	0	60	60	80	70	0	-	0	20	21
	500	0	0	60	50	80	20	0	-	0	0	
1-35	2000	10	70	80	80	80	80	0	0	0	40	20
1-41	2000	0	0	90	50	30	30	0	-	0	0	21
1-49	2000	0	0	80	60	50	30	0	-	0	0	21
1-65	2000	0	10	90	40	70	80	10	-	0	0	18
1-72	2000	50	50	80	70	50	60	40	-	0	20	21
	500	0	0	100	30	0	0	0	-	0	0	
1-100	2000	70	30	50	70	80	70	10	-	0	40	18
	500	0	50	60	80	0	0	0	-	0	0	
1-102	2000	0	30	80	40	0	0	0	-	0	0	17
	500	0	50	60	0	0	0	0	-	0	0	
1-103	2000	0	0	80	60	50	40	40	-	0	0	21
1-126	1000	80	0	60	50	-	60	20	0	0	20	22
1-224	1000	80	0	70	80	-	80	0	0	0	30	22

## 試験例2

1/170,000ヘクタールポットに畑作土壌をつめ、各種植物の種子(ノビエ、メヒシバ、アオゲイトウ、アメリカキンゴジカ、マルバアサガオ、オナモミ、イネ、コムギ、トウモロコシ及びダイズ)を播種した。播種翌日、本発明化合物を通常の製剤方法に準じて調製した水和剤又は乳剤を所定有効成分量となるように秤量し、1ヘクタール当り1500リットルの水に希釈し、小型スプレーで土壌処理した。

薬剤処理後18～21日目に各種植物の生育状態を肉眼観察し、0(無処理区と同等)～100(完全枯殺)の抑草率(%)で除草効果を評価し、第4表の結果を得た。

第4表

化合物 No.	有効成分量 (g/ha)	抑 草 率 (%)										調査日
		ノビエ	メヒシバ	アオゲイトウ	アメリカキンゴジカ	マルバアサガオ	オナモミ	イネ	コムギ	トウモロコシ	ダイズ	
1-1	2000	90	100	90	80	0	0	0	-	0	0	21
	500	80	90	100	100	0	0	30	-	0	0	
1-6	2000	100	100	70	80	-	0	20	-	40	0	21
	500	70	90	60	60	-	50	0	-	0	0	
1-7	2000	20	80	80	30	0	0	0	-	20	0	21
	500	50	50	80	10	0	0	0	-	0	0	

第4表 (続き)

化合物 No.	有効成分 量 (g/ha)	抑 草 率 (%)										調 査 日
		ノ ビ エ	メ ヒ シ バ	ア オ ゲ イ ト ウ	ア メ リ カ キ ン ゴ ジ カ	マ ル バ ア サ ガ オ	オ ナ モ ミ	イ ネ	コ ム ギ	ト ウ モ ロ コ シ	ダ イ ズ	
1-8	2000	80	90	80	80	-	0	30	-	50	0	19
	500	20	70	30	80	-	0	40	-	40	0	
1-9	2000	70	50	80	60	20	30	40	-	0	0	18
	500	70	70	70	70	10	10	30	-	0	0	
1-12	2000	20	80	0	0	-	30	0	-	0	0	20
1-13	2000	10	80	0	0	-	0	10	-	0	0	20
	500	0	30	0	0	-	0	0	-	0	0	
1-14	2000	0	80	10	0	-	0	0	-	0	0	20
1-15	2000	10	50	0	20	-	10	20	-	0	0	20
1-17	2000	0	70	0	0	-	0	0	-	0	0	20
	500	0	20	0	0	-	0	0	-	0	0	
1-29	2000	0	80	0	10	0	0	0	-	0	0	21
	500	0	30	0	30	0	0	0	-	0	0	
1-34	2000	80	100	70	80	-	0	10	-	50	0	21
1-35	2000	50	30	50	50	0	0	0	-	0	0	18
	500	20	30	40	40	0	0	40	-	0	0	
1-37	2000	30	10	60	40	0	0	0	-	0	0	21
	500	50	20	60	20	0	50	0	-	0	0	

第4表 (続き)

化合物 No.	有効成分 量 (g/ha)	抑 草 率 (%)										調 査 日
		ノ ビ エ	メ ヒ シ バ	ア オ ゲ イ ト ウ	ア メ リ カ キ ン ゴ ジ カ	マ ル バ ア サ ガ オ	オ ナ モ ミ	イ ネ	コ ム ギ	ト ウ モ ロ コ シ	ダ イ ズ	
1-40	2000	90	100	80	80	-	0	10	-	40	0	21
	500	80	100	50	80	-	0	0	-	50	0	
1-41	2000	0	80	70	0	0	0	0	-	0	0	21
1-49	2000	10	90	80	80	100	0	50	-	50	0	21
1-50	2000	60	90	100	80	0	0	100	-	0	0	21
	500	0	100	80	0	0	0	0	-	0	0	
1-51	2000	90	90	70	70	-	0	0	-	10	0	20
	500	90	80	40	70	-	0	30	-	0	0	
1-56	2000	80	90	30	30	-	30	20	-	0	0	21
	500	50	80	30	50	-	30	10	-	0	0	
1-65	2000	60	70	50	80	-	0	30	-	10	0	21
	500	50	50	30	60	-	0	20	-	0	0	
1-66	2000	50	0	70	20	-	0	0	0	0	0	21
	500	40	20	50	0	-	0	0	0	0	0	
1-68	2000	10	80	30	30	-	0	40	-	0	0	19
1-70	2000	100	90	80	60	80	0	0	-	50	0	21
	500	80	100	90	50	0	0	0	-	0	0	
1-71	1000	90	90	70	80	10	30	60	30	0	0	21

第4表 (続き)

化合物 No.	有効成分 量 (g/ha)	抑 草 率 (%)										調 査 日
		ノ ビ エ	メ ヒ シ バ	ア オ ゲ イ ト ウ	ア メ リ カ キ ン ゴ ジ カ	マ ル バ ア サ ガ オ	オ ナ モ ミ	イ ネ	コ ム ギ	ト ウ モ ロ コ シ	ダ イ ズ	
1-72	2000	90	90	80	80	-	0	0	-	50	0	21
	500	70	90	70	60	-	0	0	-	0	0	
1-73	2000	80	90	70	60	-	0	10	-	0	0	21
	500	60	100	80	50	-	0	0	-	0	0	
1-74	2000	90	90	30	40	-	0	0	-	60	0	21
	500	70	90	30	20	-	0	0	-	0	0	
1-78	2000	90	100	80	50	-	30	40	-	60	0	21
	500	30	90	60	0	-	0	0	-	0	0	
1-87	2000	90	90	50	50	-	60	30	-	10	0	21
	500	60	90	50	50	-	30	20	-	20	10	
1-88	2000	60	100	50	50	-	0	0	-	0	0	21
	500	10	80	10	10	-	0	0	-	0	0	
1-93	2000	80	90	50	40	-	30	0	-	0	0	21
	500	60	80	50	60	-	50	0	-	0	0	
1-99	1000	90	90	30	0	-	0	0	10	0	0	21
1-100	2000	100	100	70	80	-	0	50	-	70	0	21
	500	60	100	80	70	-	0	10	-	20	0	

第4表 (続き)

化合物 No.	有効成分 量 (g/ha)	抑 草 率 (%)										調 査 日
		ノ ビ エ	メ ヒ シ バ	ア オ ゲ イ ト ウ	ア メ リ カ キ ン ゴ ジ カ	マ ル バ ア サ ガ オ	オ ナ モ ミ	イ ネ	コ ム ギ	ト ウ モ ロ コ シ	ダ イ ズ	
1-101	2000	30	100	20	80	-	0	80	-	10	0	21
	500	0	80	0	10	-	0	30	-	0	0	
1-102	2000	0	80	50	80	0	0	10	-	40	0	21
	500	0	70	100	100	0	-	10	-	20	0	
1-106	2000	90	100	80	80	-	20	10	-	60	0	21
	500	60	90	50	80	-	20	0	-	0	0	
1-107	2000	50	80	30	20	-	0	0	-	0	0	21
	500	0	60	20	0	-	0	0	-	0	0	
1-108	2000	90	90	70	70	-	10	80	70	50	0	21
1-109	2000	80	80	70	60	40	0	70	50	0	10	21
1-113	1000	90	90	60	70	-	0	0	20	10	0	21
1-121	1000	100	80	0	60	-	0	0	40	0	0	21
1-122	1000	90	90	70	80	-	0	60	10	40	0	21
1-124	1000	40	90	40	70	-	0	50	0	0	0	21
1-126	1000	60	90	70	80	-	0	10	20	0	0	21
1-130	1000	30	90	20	30	-	0	40	0	10	0	21
1-134	1000	0	60	60	0	-	0	0	-	0	0	20
1-135	1000	90	100	90	90	-	0	30	50	60	0	21



第4表 (続き)

化合物 No.	有効成分 量 (g/ha)	抑 草 率 (%)										調 査 日
		ノ ビ エ	メ ヒ シ バ	ア オ ゲ イ ト ウ	ア メ リ カ キ ン ゴ ジ カ	マ ル バ ア サ ガ オ	オ ナ モ ミ	イ ネ	コ ム ギ	ト ウ モ ロ コ シ	ダ イ ズ	
1-136	250	90	90	60	80	-	0	0	20	10	0	21
1-145	1000	80	90	70	40	50	0	0	0	0	0	21
1-146	1000	90	50	50	60	-	20	0	0	0	0	21
1-147	1000	60	90	70	70	-	0	0	0	0	0	21
1-148	1000	90	80	70	70	-	0	0	0	0	0	21
1-154	1000	10	90	20	30	-	0	10	-	0	0	21
1-162	1000	60	80	100	90	-	0	20	0	0	0	20
1-163	1000	90	90	90	80	-	0	10	50	10	0	21
1-166	1000	90	100	80	80	-	0	10	70	50	0	21
1-167	1000	90	90	70	50	-	10	10	20	50	0	21
1-198	1000	80	80	30	10	0	0	0	0	0	0	21
1-204	1000	60	80	80	20	-	0	30	-	0	0	21
1-205	1000	80	90	80	0	-	0	0	0	0	0	21
1-207	1000	60	100	100	20	-	0	0	-	10	0	20

第4表 (続き)

化合物 No.	有効成分 量 (g/ha)	抑 草 率 (%)										調 査 日
		ノ ビ エ	メ ヒ シ バ	ア オ ゲ イ ト ウ	ア メ リ カ キ ン ゴ ジ カ	マ ル バ ア サ ガ オ	オ ナ モ ミ	イ ネ	コ ム ギ	ト ウ モ ロ コ シ	ダ イ ズ	
1-216	1000	0	80	0	0	-	0	0	0	0	0	21
1-222	1000	0	90	50	30	-	0	0	0	10	0	21
1-224	1000	90	100	70	70	-	0	40	10	20	0	21
1-225	1000	10	80	20	20	-	10	0	0	0	0	21
1-228	1000	100	60	20	20	-	0	30	0	20	0	21
1-242	1000	0	80	20	40	-	0	0	0	0	70	20
1-243	1000	0	60	60	0	-	0	0	0	0	0	20
1-247	1000	60	90	70	60	-	30	10	10	10	0	21
1-248	1000	80	80	80	90	-	0	0	0	40	0	21
1-249	1000	100	100	80	80	-	0	10	60	30	-	21
2-9	2000	0	80	20	0	-	0	0	-	0	0	21
2-12	2000	80	20	30	0	0	0	0	-	0	0	21
2-22	2000	0	70	0	0	-	0	0	-	0	0	21
2-42	1000	60	60	80	50	0	0	0	0	0	0	21
2-88	1000	70	0	80	30	100	0	0	0	0	0	21

## 試験例3

1/1,000,000ヘクタールポットに水田土壌を詰め、ノビエ及びホタルイの種子を播種し、その上に軽く覆土した。その後湛水深0.5~1cmの状態で温室内に静置

し、翌日又は2日後にウリカワの塊茎を植え込んだ。その後湛水深を3～4cmに保ち、ノビエ及びホタルイが0.5葉期、ウリカワが初生葉期に達した時点で、本発明化合物を通常の製剤方法に準じて調製した水和剤又は乳剤の水希釈液を、所定有効成分量になるようにピペットで均一に滴下処理した。

また1/1,000,000ヘクタールポットに水田土壌を詰め、代かきを行い、湛水深を3～4cmとし、翌日に2葉期のイネ(品種：日本晴)を移植深3cmに移植した。移植後4日目に本発明化合物を前述と同様に処理した。

薬剤処理後14日目にノビエ、ホタルイ及びウリカワの生育状態を、薬剤処理後21日目にイネの生育状態を各々肉眼観察し、0(無処理区と同等)～100(完全枯殺)の抑草率(%)で評価し、第5表の結果を得た。

第5表

化合物No.	有効成分量 (g/ha)	抑 草 率 (%)			
		ノビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
1-1	500	98	90	0	0
	250	98	90	50	-
	125	98	70	0	-
1-6	500	100	90	70	0
	250	100	90	0	-
	125	100	70	0	-
1-7	500	98	95	0	0
	250	90	80	0	-
	125	90	70	0	-
1-8	500	100	90	20	5
	250	100	60	0	-
	125	100	60	0	-
1-9	500	98	95	40	0
	250	98	95	50	-
	125	95	95	40	-
1-10	500	-	-	-	0
	250	90	90	0	-
1-11	500	50	0	50	10
1-12	500	100	30	0	0
	250	100	30	0	-
	125	98	0	0	-
1-13	500	100	0	0	0
	250	100	0	0	-
	125	98	0	0	-
1-14	500	100	60	50	0
	250	100	10	0	-
	125	98	0	0	-
1-15	500	100	60	50	0
	250	90	50	0	-
1-16	500	90	30	0	0
	250	50	0	0	-

第5表 (続き)

化合物No.	有効成分量 (g/ha)	抑 草 率 (%)			
		ノビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
1-17	500	100	0	—	0
	250	98	0	0	—
	125	90	0	0	—
1-29	500	95	95	0	0
	250	90	70	0	—
1-34	500	100	90	0	0
	250	100	70	0	—
	125	95	70	0	—
1-40	500	100	95	0	0
	250	100	60	0	—
	125	100	40	0	—
1-41	500	95	90	0	10
	250	95	80	0	—
1-49	500	10	90	0	5
1-50	500	98	95	90	40
	250	98	90	90	—
	125	50	90	—	—
1-51	500	100	95	95	10
	250	100	90	30	5
	125	100	90	0	—
1-56	500	100	95	70	0
	250	95	95	—	—
	125	90	95	—	—
1-65	500	100	90	40	5
	250	95	90	40	—
1-68	500	10	70	0	5
1-70	500	100	95	20	0
	250	100	90	0	—
	125	95	80	0	—
1-71	500	100	90	0	0
	250	100	70	0	0
	125	90	50	0	—

第5表 (続き)

化合物No.	有効成分量 (g/ha)	抑 草 率 (%)			
		ノビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
1-72	500	98	90	30	10
	250	98	90	0	-
	125	98	70	0	-
1-73	500	100	98	50	10
	250	60	95	-	-
	125	40	95	0	-
1-74	500	100	90	0	10
	250	100	90	0	-
	125	100	70	0	-
1-78	500	100	95	50	5
	250	70	95	0	-
1-87	500	100	95	90	5
	250	100	90	90	-
	125	100	90	50	-
1-88	500	100	30	40	0
	250	70	0	40	-
1-90	500	60	50	0	0
1-92	500	95	95	20	0
	250	95	90	0	0
	125	95	40	0	-
1-93	500	100	90	0	0
	250	100	80	0	-
	125	90	20	0	-
1-100	500	100	95	60	55
	250	100	95	60	-
	125	100	95	40	-
1-101	500	90	70	50	40
	250	60	70	50	-
1-103	500	10	80	0	25
1-106	500	98	95	60	10
	250	95	95	-	-
	125	90	90	0	-

第5表 (続き)

化合物No.	有効成分量 (g/ha)	抑 草 率 (%)			
		ノビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
1-107	500	0	90	0	0
1-108	500	98	98	60	30
1-110	500	100	70	20	15
1-112	500	98	30	0	0
1-113	500	98	95	90	0
1-121	500	98	90	40	5
1-122	500	98	95	95	0
1-123	500	100	90	40	15
1-124	500	98	98	90	15
1-125	500	100	70	95	0
1-126	500	100	100	90	0
1-128	500	100	20	0	0
1-129	500	—	95	40	0
1-130	500	100	30	40	5
1-131	500	95	60	40	0
1-132	500	70	60	20	15
1-133	500	100	95	50	0
1-135	500	—	95	90	15
1-136	500	100	98	95	25
1-138	500	—	80	90	0
1-139	500	—	95	70	0
1-140	500	—	98	99	0
1-141	500	—	98	30	0

第5表 (続き)

化合物No.	有効成分量 (g/ha)	抑 草 率 (%)			
		ノビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
1-142	500	100	-	0	10
1-143	500	100	70	0	0
1-145	500	100	95	40	0
1-146	500	100	90	0	5
1-147	500	98	95	0	5
1-148	500	98	95	20	10
1-153	500	100	95	0	0
1-155	500	-	70	40	0
1-156	500	70	90	0	0
1-157	500	100	60	0	-
1-162	500	-	90	70	0
1-163	500	-	95	70	5
1-166	500	-	95	0	25
1-167	500	-	90	0	10
1-169	500	100	70	98	0
1-172	500	100	95	0	0
1-173	500	100	98	50	0
1-174	500	100	80	0	0
1-175	500	-	90	0	10
1-198	500	98	90	40	0
1-199	500	90	60	60	0
1-200	500	60	60	30	0



第5表 (続き)

化合物No.	有効成分量 (g/ha)	抑 草 率 (%)			
		ノビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
1-204	500	100	95	0	0
1-205	500	-	95	20	10
1-207	500	-	90	50	0
1-208	500	98	40	0	0
1-214	500	100	85	50	20
1-215	500	60	50	50	20
1-216	500	100	90	0	10
1-218	500	100	90	-	5
1-219	500	98	90	0	0
1-222	500	98	95	0	0
1-223	500	100	90	0	0
1-224	500	-	95	0	0
1-226	500	100	95	0	0
1-227	500	95	80	0	0
1-228	500	98	70	20	10
1-229	500	95	0	0	0
1-230	500	100	0	0	0
1-231	500	95	0	0	-
1-233	500	95	10	0	0
1-237	500	90	40	0	-
1-239	500	90	30	0	0

第5表 (続き)

化合物No.	有効成分量 (g/ha)	抑 草 率 (%)			
		ノビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
1-241	500	90	30	0	-
1-242	500	-	98	90	0
1-243	500	70	70	0	0
1-247	500	95	90	0	10
1-248	500	60	95	0	10
1-249	500	-	98	30	15
1-251	500	-	90	70	0
2-10	500	0	70	20	0
2-22	500	60	70	30	-
2-42	500	90	90	0	0
2-88	500	60	50	0	-

次に、本発明の製剤例を記載する。

#### 製剤例1

- |                                |         |
|--------------------------------|---------|
| (1) 本発明化合物                     | 75 重量部  |
| (2) ゲロポンT-77 (商品名; ローヌ・プーラン社製) | 14.5重量部 |
| (3) NaCl                       | 10 重量部  |
| (4) デキストリン                     | 0.5重量部  |

以上の各成分を高速混合細粒機に入れ、さらにそこへ20%の水を加え造粒、乾燥して顆粒水和剤が得られる。

#### 製剤例2

- |                                 |        |
|---------------------------------|--------|
| (1) カオリン                        | 78 重量部 |
| (2) ラベリンFAN (商品名; 第一工業製薬 (株) 製) | 2 重量部  |

(3) ソルポール5039 (商品名 ; 東邦化学工業 (株) 製) 5 重量部

(4) カープレックス (商品名 ; 塩野義製薬 (株) 製) 15 重量部

以上、(1) ~ (4) の成分の混合物と本発明化合物とを9 : 1の重量割合で混合して水和剤が得られる。

#### 製剤例3

(1) ハイフィラーNo. 10 (商品名 ; 松村産業 (株) 製) 33 重量部

(2) ソルポール5050 (商品名 ; 東邦化学工業 (株) 製) 3 重量部

(3) ソルポール5073 (商品名 ; 東邦化学工業 (株) 製) 4 重量部

(4) 本発明化合物 60 重量部

以上の(1) ~ (4) の各成分を混合して水和剤が得られる。

#### 製剤例4

(1) 本発明化合物 4 重量部

(2) ベントナイト 30 重量部

(3) 炭酸カルシウム 61.5重量部

(4) トキサノンGR-31A (商品名 ; 三洋化成工業 (株) 製) 3 重量部

(5) リグニンスルホン酸カルシウム塩 1.5重量部

予め粉碎した(1) と、(2) 及び(3) とを混合し、そこへ(4)、(5) 及び水を加えて混合し、押出し造粒する。その後、乾燥、整粒して粒剤が得られる。

#### 製剤例5

(1) 本発明化合物 30 重量部

(2) ジークライト (商品名 ; ジークライト (株) 製) 60 重量部

(3) ニューカルゲン WG-1 (商品名 ; 竹本油脂 (株) 製) 5 重量部

(4) ニューカルゲン FS-7 (商品名 ; 竹本油脂 (株) 製) 5 重量部

(1)、(2) 及び(3) を混合し、粉碎機を通した後、(4) を加えて混練後、押出し造粒する。その後、乾燥、整粒して顆粒水和剤が得られる。

#### 製剤例6

(1) 本発明化合物 28 重量部

(2) ソプロポールFL (商品名 ; ローヌ・プーラン社製) 2 重量部

(3) ソルボール355 (商品名；東邦化学工業 (株) 製)	1	重量部
(4) IPソルベント1620 (商品名；出光石油化学 (株) 製)	32	重量部
(5) エチレングリコール	6	重量部
(6) 水	31	重量部

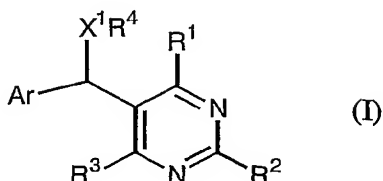
以上の (1) ～ (6) の成分を混合し、湿式粉碎機 (ダイノミル) を用いて粉碎して水性懸濁剤が得られる。

#### 産業上の利用の可能性

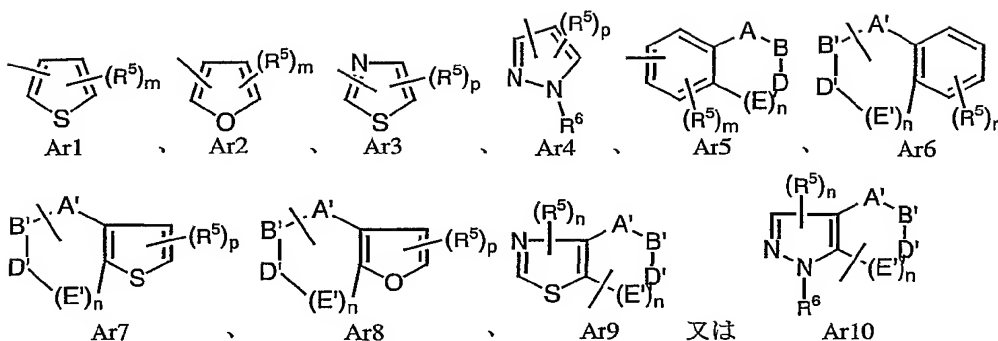
以上のように、本発明に係るピリミジン系化合物またはその塩は、除草剤の有効成分として有用なものである。

## 請求の範囲

## 1. 式 (I) ;



[式中、A r は

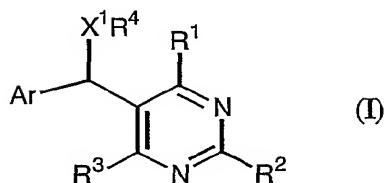


であり、A、B、D、E、A'、B'、D' 及び E' は各々酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^9)-$ 、 $=N-$ 、 $=C(R^9)-$  又は  $-C(R^9)_2-$  (ここでの  $R^9$  は同一でも異なってもよい) であり (但し、 $-A'-B'-D'-(E')_n-$  が環内の二重結合と共役してベンゼン環を形成する場合を除く)、 $R^1$  は水素原子、ハロゲン、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルコキシ、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-N(R^6)_2$  (ここでの  $R^6$  は同一であっても異なってもよいし、2つの  $R^6$  が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい) 又は  $R^8$  で置換されてもよいフェニルであり、 $R^2$  及び  $R^3$  は各々水素原子、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はアルキルチオであり、 $R^4$  は水素原子、置換されてもよいアルキル、 $-CH_2CN$ 、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-C(=X^2)R^7$ 、 $R^8$  で置

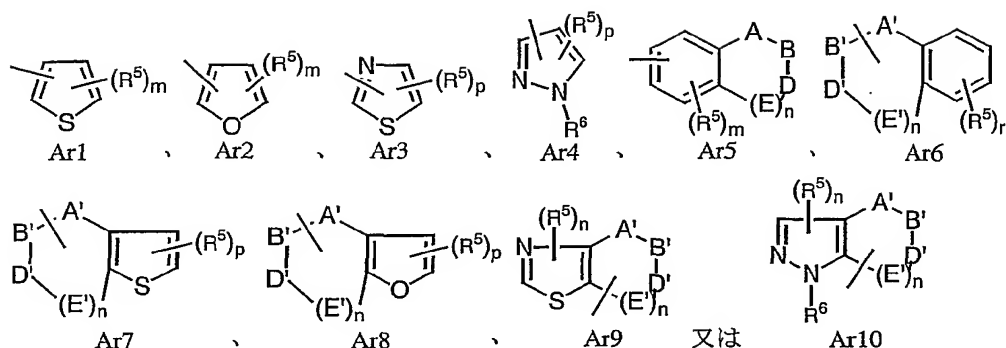
換されてもよいフェニル又は $R^8$ で置換されてもよいピリジルであり、 $R^5$ はハロゲン、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、ニトロ、シアノ、ホルミル、 $-SR^6$ 、 $-SOR^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-COR^6$ 、 $-COOR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$ （ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよいし、2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい）、 $-C(X^3R^{10})(X^4R^{11})$ 又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^6$ は水素原子、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $R^8$ で置換されてもよいフェニル又は $R^8$ で置換されてもよいピリジルであり、 $R^7$ は置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$ （ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよいし、2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい）又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^8$ はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ニトロ又はシアノであり、 $R^9$ は水素原子、ハロゲン、アルキル又はハロアルキルであり、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は各々アルキル（ $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は一緒になって環を形成することもできる）であり、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 及び $X^4$ は各々酸素原子又は硫黄原子であり、 $n$ は0又は1であり、 $m$ は0～3であり、 $p$ は0～2であり、 $r$ は0～4であり、 $m$ 、 $p$ 又は $r$ が2以上である場合、 $R^5$ は同一であっても異なってもよい、但し、(1)  $Ar$ がチエニル又はフリルであり、 $R^1$ がハロアルキルであり、且つ、 $R^2$ 及び $R^3$ がともに水素原子である場合、(2)  $Ar$ がチエニル又はフリルであり、 $X^1$ が酸素原子であり、 $R^1$ がアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル、ハロシクロアルキル又は置換されてもよいフェニル（ここでの置換基はハロゲン、アルキル又はハロアルキル）であり、且つ、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ がともに水素原子である場合、(3)  $Ar$ が置換されてもよいチアゾリル（ここでの置換基はハロゲン、アルキル、フルオロアルキル、アルコキシ、ジアルキ

ルアミノ、アルコキシカルボニル、アルカノイル、ニトロ又はシアノ) であり、 $X^1$  が酸素原子であり、 $R^1$  が  $-SR^6$  であり、 $R^4$  が水素原子、アルキル、フルオロアルキル、アルキルチオアルキル、アルケニル、アルキニル、アルカノイル又は置換されてもよいベンゾイル (ここでの置換基はハロゲン又はアルキル) であり、且つ、 $R^6$  が置換されてもよいフェニル (ここでの置換基はハロゲン、アルキル、フルオロアルキル又はシアノ) である場合、(4) Ar が置換されてもよいチアゾリル (ここでの置換基はアルキル、トリフルオロメチル、フェニルアルキル又はトリフェニルメチル) であり、 $X^1$  が酸素原子又は硫黄原子であり、 $R^1$  が水素原子又はメチルであり、 $R^2$  及び  $R^3$  が各々水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル又はメトキシであり、且つ、 $R^4$  が置換されてもよいフェニル (ここでの置換基はフッ素原子、塩素原子、臭素原子、アルキル、クロロアルキル又はブromoアルキル) である場合並びに (5) Ar が置換されてもよいピラゾール-5-イル (ここでの置換基は、置換されてもよいフェノキシ、置換されてもよいフェニルチオ、置換されてもよいフェニルスルフィニル又は置換されてもよいフェニルスルホニル) であり、 $X^1$  が酸素原子であり、 $R^4$  が水素原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、フェニルアルキル (フェニル部分は置換されていてもよい)、アルケニル、アルキニル又は  $-COR^7$  であり、 $R^7$  がアルキル、ハロアルキル、フェニルアルキル (フェニル部分は置換されていてもよい)、アルコキシ、 $-N(R^6)_2$  又は置換されてもよいフェニルであり、且つ、 $R^6$  がアルキル又は置換されてもよいフェニルである場合を除く] で表されるピリミジン系化合物又はその塩。

2. 式 (I) ;



[式中、Ar は

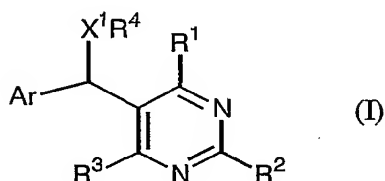


であり、A、B、D、E、A'、B'、D' 及び E' は各々酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^9)-$ 、 $=N-$ 、 $=C(R^9)-$  又は  $-C(R^9)_2-$  (ここでの  $R^9$  は同一でも異なってもよい) であり (但し、 $-A'-B'-D'-(E')_n-$  が環内の二重結合と共役してベンゼン環を形成する場合を除く)、 $R^1$  は水素原子、置換されてもよい  $C_{1-6}$  アルキル、置換されてもよい  $C_{2-6}$  アルケニル、置換されてもよい  $C_{2-6}$  アルキニル、置換されてもよい  $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $-SR^6$  又は  $R^8$  で置換されてもよいフェニルであり、 $R^2$  及び  $R^3$  は各々水素原子、ハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル又は  $C_{1-6}$  アルコキシであり、 $R^4$  は水素原子、置換されてもよい  $C_{1-6}$  アルキル、 $-CH_2CN$ 、置換されてもよい  $C_{2-6}$  アルケニル、置換されてもよい  $C_{2-6}$  アルキニル、置換されてもよい  $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $-C(=X^2)$   $R^7$  又は  $R^8$  で置換されてもよいフェニルであり、 $R^5$  はハロゲン、置換されてもよい  $C_{1-6}$  アルキル、置換されてもよい  $C_{2-6}$  アルケニル、置換されてもよい  $C_{2-6}$  アルキニル、置換されてもよい  $C_{3-6}$  シクロアルキル、ニトロ、シアノ、ホルミル、 $-SR^6$ 、 $-SOR^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-COR^6$ 、 $-COOR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$  (ここでの  $R^6$  は同一であっても異なってもよく、或は2つの  $R^6$  が一緒になって環を形成することもできる) 又は  $R^8$  で置換されてもよいフェニルであり、 $R^6$  は置換されてもよい  $C_{1-6}$  アルキル、置換されてもよい  $C_{2-6}$  アルケニル、置換されてもよい  $C_{2-6}$  アルキニル、置換されてもよい  $C_{3-6}$  シクロアルキル又は  $R^8$  で置換されてもよいフェニルであり、 $R^7$  は置換されてもよい  $C_{1-6}$  アルキル、置換されてもよい  $C_{2-6}$  アルケニル、置換されてもよい  $C_{2-6}$  アルキニル、置換されてもよい  $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N$  (

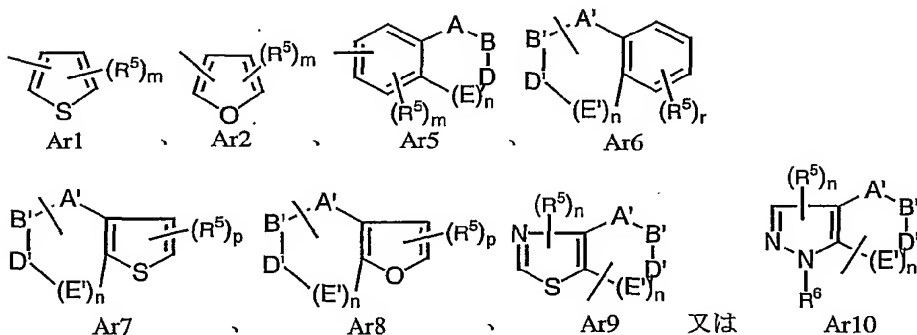


$R^6)_2$  (ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよく、或は2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもできる) 又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^8$ はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル又は $C_{1-6}$ ハロアルキルであり、 $R^9$ は水素原子、ハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル又は $C_{1-6}$ ハロアルキルであり、 $X^1$ 及び $X^2$ は各々酸素原子又は硫黄原子であり、 $n$ は0又は1であり、 $m$ は0～3であり、 $p$ は0～2であり、 $r$ は0～4であり、 $m$ 、 $p$ 又は $r$ が2以上である場合、 $R^5$ は同一であっても異なってもよい請求項1のピリミジン系化合物又はその塩。

3. 式(I) ;



[式中、Arは

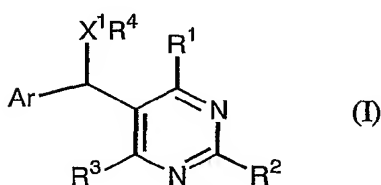


であり、A、B、D、E、A'、B'、D'及びE'は各々酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^9)-$ 、 $=N-$ 、 $=C(R^9)-$ 又は $-C(R^9)_2-$  (ここでの $R^9$ は同一でも異なってもよい) であり (但し、 $-A'-B'-D'-(E')_n-$  が環内の二重結合と共役してベンゼン環を形成する場合を除く)、 $R^1$ は水素原子、ハロゲン、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルコキシ、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-N(R^6)_2$  (ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよいし、2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもでき、更には、環

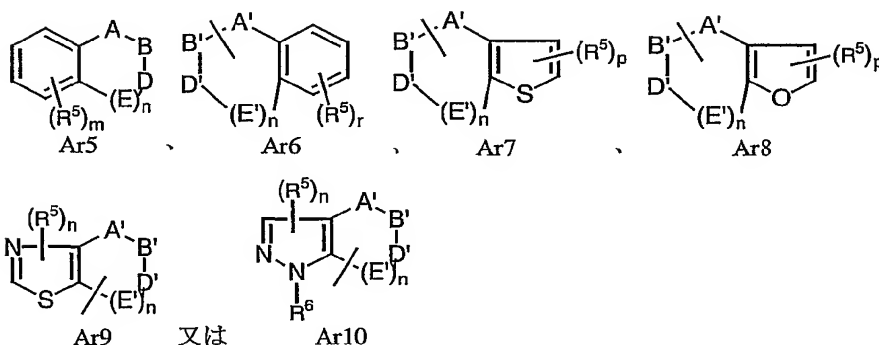
を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい) 又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^2$ 及び $R^3$ は各々水素原子、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はアルキルチオであり、 $R^4$ は水素原子、置換されてもよいアルキル、 $-CH_2CN$ 、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-C(=X^2)R^7$ 、 $R^8$ で置換されてもよいフェニル又は $R^8$ で置換されてもよいピリジルであり、 $R^5$ はハロゲン、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、ニトロ、シアノ、ホルミル、 $-SR^6$ 、 $-SOR^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-COR^6$ 、 $-COOR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$  (ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよいし、2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい)、 $-C(X^3R^{10})(X^4R^{11})$  又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^6$ は水素原子、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $R^8$ で置換されてもよいフェニル又は $R^8$ で置換されてもよいピリジルであり、 $R^7$ は置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$  (ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよいし、2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい) 又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^8$ はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ニトロ又はシアノであり、 $R^9$ は水素原子、ハロゲン、アルキル又はハロアルキルであり、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は各々アルキル ( $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は一緒になって環を形成することもできる) であり、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 及び $X^4$ は各々酸素原子又は硫黄原子であり、 $n$ は0又は1であり、 $m$ は0～3であり、 $p$ は0～2であり、 $r$ は0～4であり、 $m$ 、 $p$ 又は $r$ が2以上である場合、 $R^5$ は同一であっても異なってもよく、但し、(1)  $Ar$ がチエニル又はフリルであり、 $R^1$ がハロアルキルであり、且つ、 $R^2$ 及び $R^3$ がともに水素原子である場合並びに (2)  $Ar$ がチエニル又はフリルであり、

$X^1$  が酸素原子であり、 $R^1$  がアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル、ハロシクロアルキル又は置換されてもよいフェニル（ここでの置換基はハロゲン、アルキル又はハロアルキル）であり、且つ、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  がともに水素原子である場合を除く] で表されるピリミジン系化合物又はその塩。

4. 式 (I) ;



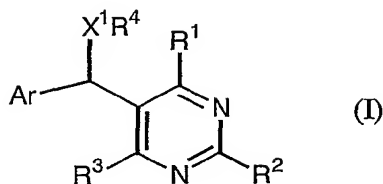
[式中、A r は



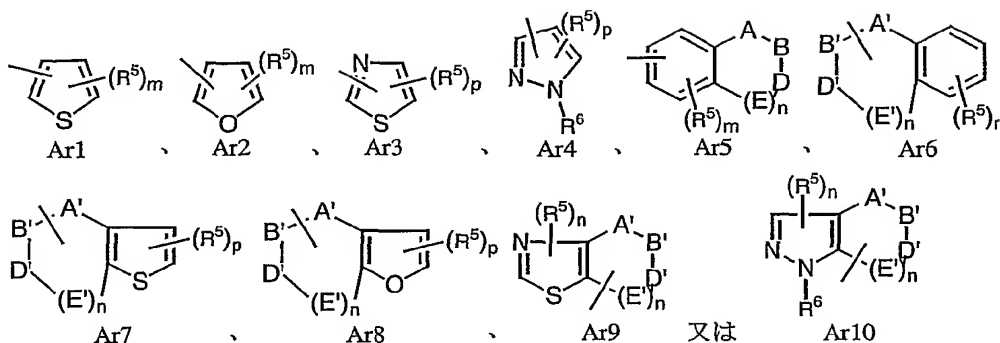
であり、A、B、D、E、A'、B'、D' 及び E' は各々酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^9)-$ 、 $=N-$ 、 $=C(R^9)-$  又は  $-C(R^9)_2-$ （ここでの  $R^9$  は同一でも異なってもよい）であり（但し、 $-A'-B'-D'-(E')_n-$  が環内の二重結合と共役してベンゼン環を形成する場合を除く）、 $R^1$  は水素原子、ハロゲン、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルコキシ、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-N(R^6)_2$ （ここでの  $R^6$  は同一であっても異なってもよいし、2つの  $R^6$  が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい）又は  $R^8$  で置換されてもよいフェニルであり、 $R^2$  及び  $R^3$  は各々水素原子、ハロゲン、アルキル、ハ

ロアルキル、アルコキシ又はアルキルチオであり、 $R^4$ は水素原子、置換されてもよいアルキル、 $-CH_2CN$ 、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-C(=X^2)R^7$ 、 $R^8$ で置換されてもよいフェニル又は $R^8$ で置換されてもよいピリジルであり、 $R^5$ はハロゲン、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、ニトロ、シアノ、ホルミル、 $-SR^6$ 、 $-SOR^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-COR^6$ 、 $-COOR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$ （ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよいし、2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい）、 $-C(X^3R^{10})(X^4R^{11})$ 又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^6$ は水素原子、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $R^8$ で置換されてもよいフェニル又は $R^8$ で置換されてもよいピリジルであり、 $R^7$ は置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$ （ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよいし、2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい）又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^8$ はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ニトロ又はシアノであり、 $R^9$ は水素原子、ハロゲン、アルキル又はハロアルキルであり、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は各々アルキル（ $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は一緒になって環を形成することもできる）であり、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 及び $X^4$ は各々酸素原子又は硫黄原子であり、 $n$ は0又は1であり、 $m$ は0～3であり、 $p$ は0～2であり、 $r$ は0～4であり、 $m$ 、 $p$ 又は $r$ が2以上である場合、 $R^5$ は同一であっても異なってもよい]で表されるピリミジン系化合物又はその塩。

5. 式(I)；



[式中、Ar は

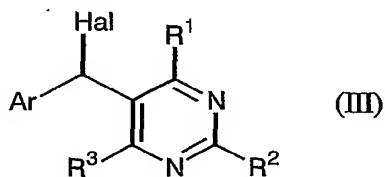


であり、A、B、D、E、A'、B'、D' 及び E' は各々酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^9)-$ 、 $=N-$ 、 $=C(R^9)-$  又は  $-C(R^9)_2-$  (ここでの  $R^9$  は同一でも異なってもよい) であり (但し、 $-A'-B'-D'-(E')_n-$  が環内の二重結合と共役してベンゼン環を形成する場合を除く)、 $R^1$  は水素原子、ハロゲン、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルコキシ、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-N(R^6)_2$  (ここでの  $R^6$  は同一であっても異なってもよいし、2つの  $R^6$  が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい) 又は  $R^8$  で置換されてもよいフェニルであり、 $R^2$  及び  $R^3$  は各々水素原子、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はアルキルチオであり、 $R^4$  は水素原子、置換されてもよいアルキル、 $-CH_2CN$ 、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-C(=X^2)R^7$ 、 $R^8$  で置換されてもよいフェニル又は  $R^8$  で置換されてもよいピリジルであり、 $R^5$  はハロゲン、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、ニトロ、シアノ、ホルミル

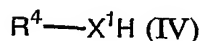
、 $-SR^6$ 、 $-SOR^6$ 、 $-SO_2R^6$ 、 $-COR^6$ 、 $-COOR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$ （ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよいし、2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい）、 $-C(X^3R^{10})(X^4R^{11})$ 又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^6$ は水素原子、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $R^8$ で置換されてもよいフェニル又は $R^8$ で置換されてもよいピリジルであり、 $R^7$ は置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-N(R^6)_2$ （ここでの $R^6$ は同一であっても異なってもよいし、2つの $R^6$ が一緒になって環を形成することもでき、更には、環を形成する際に当該環中に酸素原子を含有していてもよい）又は $R^8$ で置換されてもよいフェニルであり、 $R^8$ はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ニトロ又はシアノであり、 $R^9$ は水素原子、ハロゲン、アルキル又はハロアルキルであり、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は各々アルキル（ $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は一緒になって環を形成することもできる）であり、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 及び $X^4$ は各々酸素原子又は硫黄原子であり、 $n$ は0又は1であり、 $m$ は0～3であり、 $p$ は0～2であり、 $r$ は0～4であり、 $m$ 、 $p$ 又は $r$ が2以上である場合、 $R^5$ は同一であっても異なってもよい、但し、(1)  $Ar$ がチエニル又はフリルであり、 $R^1$ がハロアルキルであり、且つ、 $R^2$ 及び $R^3$ がともに水素原子である場合、(2)  $Ar$ がチエニル又はフリルであり、 $X^1$ が酸素原子であり、 $R^1$ がアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル、ハロシクロアルキル又は置換されてもよいフェニル（ここでの置換基はハロゲン、アルキル又はハロアルキル）であり、且つ、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ がともに水素原子である場合、(3)  $Ar$ が置換されてもよいチアゾリル（ここでの置換基はハロゲン、アルキル、フルオロアルキル、アルコキシ、ジアルキルアミノ、アルコキシカルボニル、アルカノイル、ニトロ又はシアノ）であり、 $X^1$ が酸素原子であり、 $R^1$ が $-SR^6$ であり、 $R^4$ が水素原子、アルキル、フルオロアルキル、アルキルチオアルキル、アルケニル、アルキニル、アルカノイル

又は置換されてもよいベンゾイル（ここでの置換基はハロゲン又はアルキル）であり、且つ、 $R^6$ が置換されてもよいフェニル（ここでの置換基はハロゲン、アルキル、フルオロアルキル又はシアノ）である場合、(4) Arが置換されてもよいチアゾリル（ここでの置換基はアルキル、トリフルオロメチル、フェニルアルキル又はトリフェニルメチル）であり、 $X^1$ が酸素原子又は硫黄原子であり、 $R^1$ が水素原子又はメチルであり、 $R^2$ 及び $R^3$ が各々水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル又はメトキシであり、且つ、 $R^4$ が置換されてもよいフェニル（ここでの置換基はフッ素原子、塩素原子、臭素原子、アルキル、クロロアルキル又はブromoアルキル）である場合並びに(5) Arが置換されてもよいピラゾール-5-イル（ここでの置換基は、置換されてもよいフェノキシ、置換されてもよいフェニルチオ、置換されてもよいフェニルスルフィニル又は置換されてもよいフェニルスルホニル）であり、 $X^1$ が酸素原子であり、 $R^4$ が水素原子、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、フェニルアルキル（フェニル部分は置換されていてもよい）、アルケニル、アルキニル又は $-COR^7$ であり、 $R^7$ がアルキル、ハロアルキル、フェニルアルキル（フェニル部分は置換されていてもよい）、アルコキシ、 $-N(R^6)_2$ 又は置換されてもよいフェニルであり、且つ、 $R^6$ がアルキル又は置換されてもよいフェニルである場合を除く]で表されるピリミジン系化合物又はその塩の製造方法であって、

(I) 式 (III) ；

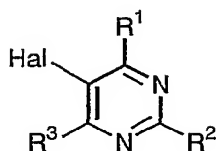


[式中、Ar、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ は前述の通りであり、Halはハロゲンである]で表される化合物と、式 (IV) ；



[式中、 $R^4$ 及び $X^1$ は前述の通りである]で表される化合物とを反応させるか、

(2) 式 ;

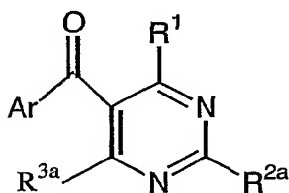


[式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びHalは前述の通りである]で表される化合物と、アルキルリチウム又はフェニルリチウムとを反応させ、次いで式 ;

ArCHO

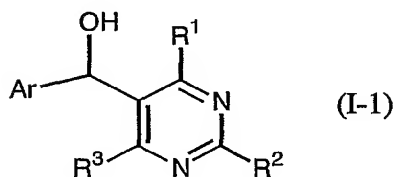
[式中、A r は前述の通りである]で表される化合物と反応させるか、

(3) 式 ;



[式中、A r 及びR<sup>1</sup>は前述の通りであり、R<sup>2a</sup>及びR<sup>3a</sup>は各々水素原子又はアルキルである]で表される化合物を還元するか、或は

(4) 式 (I-1) ;



[式中、A r、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は前述の通りである]で表される化合物と、式 (I I) ;

R<sup>4a</sup>—Y (II)

[式中、R<sup>4a</sup>は置換されてもよいアルキル、—CH<sub>2</sub>CN、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、—C



(=X<sup>2</sup>) R<sup>7</sup>又はR<sup>8</sup>で置換されてもよいフェニル (X<sup>2</sup>、R<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>は前述の通り) であり、Yはハロゲン又は有機スルホン酸残基である]で表される化合物とを反応させることを特徴とする方法。

6. 請求項1のピリミジン系化合物又はその塩を有効成分として含有する除草剤。

7. 請求項1のピリミジン系化合物又はその塩の有効成分量を施用して有害雑草を防除する方法。

8. 請求項1のピリミジン系化合物又はその塩の有効成分量を畑に施用して有害雑草を防除する方法。

9. 請求項1のピリミジン系化合物又はその塩の有効成分量を水田に施用して有害雑草を防除する方法。

10. 請求項1のピリミジン系化合物又はその塩の少なくとも1種と、他の除草剤の有効成分化合物の少なくとも1種とを含有する混合除草性組成物。

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/10060

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.<sup>7</sup> C07D409/06, 405/06, 417/06, 403/06, 239/38, 495/04, 401/06, 239/26, 239/34, 239/30, 409/14, 411/14, A01N43/54, 43/78, 43/90, 47/16, 55/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.<sup>7</sup> C07D409/06, 405/06, 417/06, 403/06, 239/38, 495/04, 401/06, 239/26, 239/34, 239/30, 409/14, 411/14, A01N43/54, 43/78, 43/90, 47/16, 55/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 8-73441 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 19 March, 1996 (19.03.1996), Claims & WO 95/12582 A	1-10

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
04 February, 2002 (04.02.02)

Date of mailing of the international search report  
19 February, 2002 (19.02.02)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07D409/06, 405/06, 417/06, 403/06, 239/38,  
495/04, 401/06, 239/26, 239/34, 239/30, 409/14,  
411/14, A01N43/54, 43/78, 43/90, 47/16, 55/00

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07D409/06, 405/06, 417/06, 403/06, 239/38,  
495/04, 401/06, 239/26, 239/34, 239/30, 409/14,  
411/14, A01N43/54, 43/78, 43/90, 47/16, 55/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	JP 8-73441 A (日産化学工業株式会社) 1996. 03.19 特許請求の範囲 & WO 95/12582 A	1-10

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの  
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの  
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)  
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献  
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの  
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの  
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの  
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

04.02.02

国際調査報告の発送日

19.02.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

内藤 伸一



4P

8615

電話番号 03-3581-1101 内線 3492